

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 3 月 20 日 (20.03.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/022821 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 231/12, 261/08, 401/04, 401/14, 403/12, 405/12, 405/14, 409/12, 413/12, 413/14, 417/12, 417/14, A61K 31/395, 31/42, 31/422, 31/4439, 31/454, 31/496, 31/5377, 31/4245, 31/4196, 31/4178, 31/427, 31/4155, 31/4545, 31/55, A61P 9/00, 9/08, 13/12, 43/00

2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 中村 年男 (NAKAMURA, Toshio) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/09054

(74) 代理人: 北川 富造 (KITAGAWA, Tomizo); 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社 知的財産部 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2002 年 9 月 5 日 (05.09.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-269896 2001 年 9 月 6 日 (06.09.2001) JP
特願2001-269897 2001 年 9 月 6 日 (06.09.2001) JP
特願2001-396526
2001 年 12 月 27 日 (27.12.2001) JP

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 佐藤 正和 (SATO, Masakazu) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 柿沼 浩行 (KAKINUMA, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 梅宮 広樹 (UMEMIYA, Hiroki) [JP/JP]; 〒170-8633 東京都豊島区高田 3 丁目

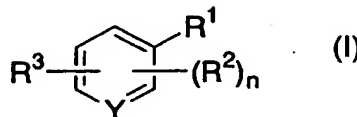
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: HETEROCYCLE DERIVATIVE HAVING 20-HETE-PRODUCING ENZYME INHIBITORY ACTIVITY

(54) 発明の名称: 20-HETE 産生酵素阻害作用を有するヘテロ環誘導体



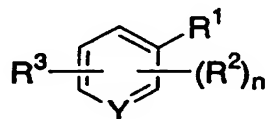
(57) Abstract: A heterocycle derivative represented by the formula (I) (wherein Y is carbon or nitrogen; R¹ is a heterocyclic group; R² is hydrogen, C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, or halogeno; n is an integer of 1 to 4; and R³ is morpholino, pyrrolidino, 4-C₁₋₆-alkoxycarbonylpiperazin-1-yl-propyl, etc.) or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative. Also provided is a medicine which inhibits a 20-HETE-producing enzyme, which participates in microvascular constrictive/dilative activity, cell proliferation activity, and other activity in principal organs such as the kidneys and cerebral blood vessels.

[続葉有]



(57) 要約:

式



(式中、Yは炭素原子又は窒素原子であり、R¹はヘテロ環基であり、R²は水素原子、C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシ基又はハロゲン原子であり、nは1～4の整数であり、R³はモルホリノ基、ピロリジノ基、4-C₁₋₆アルコキシカルボニルピペラジン-1-イル-プロピル基などである。)で表されるヘテロ環誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

腎臓、脳血管等の主要臓器における微小血管収縮、拡張作用、細胞増殖惹起作用等に関与している20-HETEの産生酵素を阻害する薬剤を提供する。

明 細 書

20-HETE 産生酵素阻害作用を有するヘテロ環誘導体

技術分野

本発明は、アラキドン酸から生合成される 20-ヒドロキシエイコサテトラエン酸 (20-HETE) の産生酵素を阻害するヘテロ環誘導体に関する。

背景技術

アラキドン酸から産生される生理活性物質として、シクロオキシゲナーゼによって産生されるプロスタグランジン類及びリポキシゲナーゼによって産生されるロイコトリエン類が広く知られている。しかし、近年、チトクローム P450 属に属する酵素によってアラキドン酸から産生される 20-HETE が生体内で多彩な働きをしていることが明らかとされつつある。これまでに 20-HETE は腎臓、脳血管等の主要臓器において微小血管を収縮又は拡張させることや細胞増殖を惹起することが明らかにされており、生体内で重要な生理作用を演じていると共に各種腎疾患、脳血管疾患、循環器疾患等の病態に深く関与していることが示唆されている (J. Vascular Research, 第 32 巻, 79 頁, 1995 年, Am. J. Physiol., 第 277 巻, R607 頁, 1999 年, Physiol. Rev., 第 82 巻, 131 頁, 2002 年)。

このような背景の中で、N'-ヒドロキシフェニルホルムアミジン誘導体やカルボン酸誘導体に強い 20-HETE 産生酵素阻害作用 (国際特許公開 W00132164、W001096309、W00168610 号明細書、日本公開特許公報 JP01354658、JP01354646 号明細書) があると報告されている。

本発明の化合物に類似したヘテロ環誘導体としては、例えば、ベンゼン環上のパラ位が置換 C₁₋₄アルキル基、置換アルカノイル基、置換フェニルアルコキシ基又は置換アルコキシ基である 1-フェニル-イミダゾール誘導体が、それぞれニトリックオキシド合成酵素阻害活性 (国際特許公開 W09715555 号明細書)、脳神経細胞死抑制効果 (国際特許公開 W09418172 号明細書)、抗高脂血症若しくは動脈硬化 (国際特許公開 W09529163 号明細書) 又は抗不整脈、抗高血圧若しくは高虚

血治療剤（ヨーロッパ特許公開 EP0306440 号明細書、米国特許 US5202346 号明細書）を有すると報告されている。トリアゾール誘導体については、1-(4-メトキシフェニル)-1H-[1,2,4]トリアゾールの合成反応に関する研究や（Tetrahedron, 第 56 巻, 第 3 項, 2000 年）、1-(4-アゾリルアルキルコキシ)-1H-[1,2,4]トリアゾールの抗ウイルス活性又は除草剤としての研究がある（ヨーロッパ特許公開 EP035636 号明細書又は日本特許公開公報 11171877 号明細書）。5-(5-イソオキサゾリル)サリチル酸には、抗炎症作用があると報告されている（J. Med. Chem., 第 21 巻, 1100 頁, 1978 年）。また、1-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾールについては、合成やルイス酸複合体との構造解析に関する報告がある（J. Chem. Soc. Dalton Trans., 第 18 巻, 3065 項, 1998 年、Polyhedron 第 17 巻, 2115 項, 1998 年、Synlett 第 8 巻, 959 項, 1997 年、Inorg. Chem. 第 31 巻, 3943 項, 1992 年、Synthesis 第 6-7 巻, 690 項, 1985 年、又は J. Orgnomet. Chem. 第 534 巻, 159 項, 1997 年）。1-フェニル-ピラゾールの 2 又は 3 位にピペラジニルアルコキシ基、C₁₋₄アルコキシ基が置換した誘導体が、それぞれ抗不安作用（日本公開特許公報 JP58159413 号明細書）、抗真菌作用（ヨーロッパ特許公開 EP538156 号明細書）に関する記載がある。

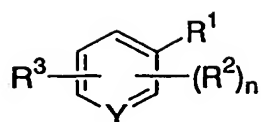
しかしながら、これらのヘテロ環誘導体のいずれについても、20-HETE 産生酵素阻害作用は報告されていない。

発明の開示

本発明は、腎臓、脳血管等の主要臓器における微小血管収縮又は拡張、あるいは細胞増殖惹起に關与する 20-HETE の産生酵素を阻害する薬剤を提供することを目的としている。

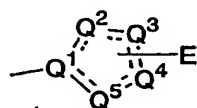
本発明者らは前記課題を解決する目的で鋭意探索研究した結果、ある特異な部分構造を有する芳香族化合物、特に様々な置換基を 4 位に有するある種の芳香族ヘテロ環置換ベンゼンあるいはピリジン誘導体が意外にも 20-HETE 産生酵素阻害作用を有することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、式

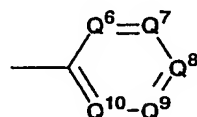


{式中、Yは炭素原子又は窒素原子であり（但し、Yが窒素原子のとき、 R^2 及び R^3 は窒素原子上に置換しない）、

R^1 は式



（式中、 $Q^1 \sim Q^5$ のうち少なくとも1個は窒素原子であり、その他は炭素原子、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子であり、Eは水素原子又は C_{1-4} アルキル基である。）で表されるヘテロ環基又は式



（式中、 $Q^6 \sim Q^{10}$ のうち1又は2個は窒素原子であり、その他は炭素原子である。）で表されるヘテロ環基であり、

R^2 は水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はハロゲン原子であり、 n は1～4の整数であり、

R^3 はモルホリノ基、

ピロリジノ基、

4- C_{1-6} アルコキシカルボニルピペラジン-1-イループロピル基、

C_{3-14} アルコキシ基、

1～6個のハロゲン原子で置換された C_{2-14} アルコキシ基、

C_{3-10} シクロアルコキシ基、

C_{2-14} アルケニルオキシ基、

C₃₋₁₄アルキニルオキシ基、

1-フェニル-2-プロピニルオキシ基

ビス(N,N-ジメチルアミノメチル)メトキシ基、

式 R⁴-A-O-

[式中、

AはC₁₋₁₀アルキレン基であり、

R⁴はC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルコキシ基、

C₁₋₁₀アルコキシ基、

C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキセタニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基、

ベンゾジオキサニル基、

C₁₋₆アルキルチオ基、

C₄₋₁₀シクロアルケニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基、

ビスクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基、

ピロリル基、

フリル基、

チエニル基、

2-オキソピロリジン-1-イル基、

ジヒドロピラニル基、

カルバゾリル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基、

4-カルボキシピペリジノカルボニル基、

ピリジル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基又はピペリジノメチル基」で置換されたピリジル基、

2-ピリジルオキシ基、

フェニル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基」から選ばれる基で置換されたフェニル基、

チアゾリル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたチアゾリル基、

アミノ基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、

アニリノ基、

N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該アニリノ基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

ベンジルアミノ基、

N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換さ

れてもよい。)、

N, N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキルアミノ基、

アジリジン-1-イル基、

モルホリノ基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、

ピペリジノ基、

「カルボキシ基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イルカルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル基、ピロリジン-1-イルメチル基、モルホリノメチル基又はN, N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基」で置換されたピペリジノ基、

ペルヒドロアゾシン-1-イル基、

ペルヒドロアゼピン-1-イル基、

イミダゾリン-2-オン-1-イル基、

オキサゾリジン-3-イル基、

1-C₁₋₆アルキル-2-オキソピペラジン-4-イル基、

フェノキシ基、

オキサゾリル基、

ビフェニル基、

フェニルチオ基

N-メチルインドール-3-イル基、

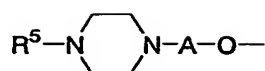
ベンゾ[1, 2, 5]オキサジアゾール基、

2-ピラジル基、

ピリミジル基又は

C₁₋₆アルキル基で置換されたピリミジル基である。]で表される基

又は式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R⁵は水素原子、

C₁₋₆アルキル基、

ヒドロキシエチル基、

オキソラニルメチル基、

ピリジルメチル基、

2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基、

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基、

4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、

N-アセチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

オキソラニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イルカルボニル基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジ

C₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基、

3-(4-メチルシクロヘキシル)プロピオニル基、

2-(2-オキソピロリジン-1-イル)アセチル基、

3-メチル-2-ブテノイル基、

カルバモイル基、

「 C_{1-6} アルキル基又は C_{3-8} シクロアルキル基」で置換されたカルバモイル基、

ベンジル基、

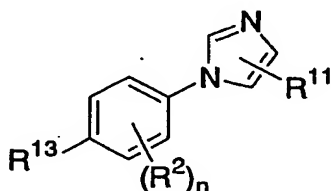
「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基及びハロゲン原子」から選ばれる基で置換されたベンジル基、

ベンジルスルホニル基又は

C_{1-6} アルキルスルホニル基である。] で表される基である。}

で表されるヘテロ環誘導体又はその製薬学的に許容される塩を有効成分として含むことを特徴とする20-HETE産生酵素阻害剤である。

また、他の本発明は、式



{式中、 R^2 及び n は前記と同意義であり、

R^{11} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基であり、

R^{13} はモルホリノ基

C_{3-10} シクロアルコキシ基、

1-フェニル-2-プロピニルオキシ基、

式 $R^{14}-A-O-$

[式中、

Aは前記と同意義であり、

R^{14} は C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-10} アルコキシ基、

C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、

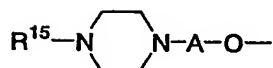
C_{2-14} アルカノイル基、

ジオキサニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキサニル基、
 ジオキサニル基、
 C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキサニル基、
 ベンゾジオキサニル基、
 C_{1-6} アルキルチオ基、
 ビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、
 N,N -ジ C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ基、
 ピロリル基、
 フリル基、
 チエニル基又は
 2-オキソピロリジン-1-イル基である。] で表される基又は

式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R^{15} は水素原子、

C_{1-6} アルキル基、
 ヒドロキシエチル基、
 オキサニルメチル基、
 ピリジルメチル基、
 2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、
 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-6} アルキル基、
 N,N -ジ C_{1-4} アルキルアミノ C_{1-4} アルキル基、
 C_{2-6} アルコキシカルボニル基、
 C_{3-8} シクロアルキルカルボニル基、
 4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、
 N -アセチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、
オキソラニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イル-カルボニル基、
C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基、

3-(4-メチルシクロヘキシル)プロピオニル基、
2-(2-オキソピロリジン-1-イル)アセチル基、
3-メチル-2-ブテノイル基、
カルバモイル基、

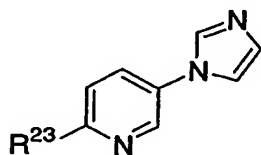
「C₁₋₆アルキル基又はC₃₋₈シクロアルキル基」で置換されたカルバモイル基、

ベンジルスルホニル基又は

C₁₋₆アルキルスルホニル基である。] で表される基である。}

で表されるイミダゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩である。

また、他の本発明は、式、



{式中、R²³は、

C₁₋₁₄アルコキシ基、

1~6個のハロゲン原子で置換されたC₂₋₁₄アルコキシ基、

C₃₋₁₀シクロアルコキシ基、

C₂₋₁₄アルケニルオキシ基、

C₃₋₁₄アルキニルオキシ基、

式 $R^{24}-A-O-$

[式中、Aは前記と同意義であり、

R^{24} は C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-6} アルキル基で置換された C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-10} アルコキシ基、

C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、

C_{2-10} アルケニルオキシ基、

C_{2-14} アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

オキセタニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたオキセタニル基、

C_{1-6} アルキルチオ基、

C_{4-10} シクロアルケニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換された C_{4-10} シクロアルケニル基、

N,N-ジ C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ基、

ピロリル基、

ピリジル基、

カルバゾリル基、

C_{2-6} アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

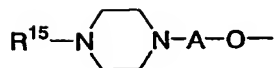
C_{1-6} アルキル基で置換されたピペリジル基、

フェニル基、

「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、ハロゲン原子、フェ

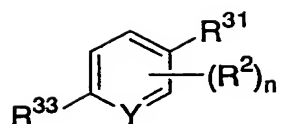
ニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,
N-ジメチルアミノ基」から選ばれる基の1又は2個で置換され
たフェニル基、
アミノ基、
N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、
アニリノ基、
N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該アニリノ基はC₁₋₆アルキ
ル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよ
い。）、
ベンジルアミノ基、
N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基は
C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換
されてもよい。）、
N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキ
ルアミノ基、
モルホリノ基、
C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、
ペルヒドロアゾシン-1-イル基、
ペルヒドロアゼピン-1-イル基、
2-オキソピロリジン-1-イル基である。] で表される基又は

式



（式中、A及びR¹⁵は前記と同意義である。）で表される基である。）
で表されるイミダゾール-1-イル-ピリジン誘導体又はその製薬学的に許容さ
れる塩である。

また、他の本発明は、式



{式中、Y、 R^2 及びnは前記と同意義であり、

R^{31} は C_{1-4} アルキル基で置換されてもよいピラゾール-3-イル基、イソキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-5-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、ピラジン-2-イル基であり、

R^{33} は4- C_{1-6} アルコキシカルボニルピペラジン-1-イル-プロピル基、

1~6個のハロゲン原子で置換された C_{2-14} アルコキシ基、

C_{3-10} シクロアルコキシ基、

C_{2-14} アルケニルオキシ基、

C_{3-14} アルキニルオキシ基、

1-フェニル-2-プロピニルオキシ基

ビス(N,N-ジメチルアミノメチル)メトキシ基、

式 $R^{34}-A-O-$

[式中、

Aは前記と同意義であり、

R^{34} は C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-6} アルキル基で置換された C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-10} アルコキシ基、

C_{-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、

C_{2-10} アルケニルオキシ基、

C_{2-10} アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキセタニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基、

ベンゾジオキサニル基、

C₁₋₆アルキルチオ基、

C₄₋₁₀シクロアルケニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基、

ビスクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、

ピロリル基、

フリル基、

チエニル基、

ピリジル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基又はピペリジノメチル基」で置換されたピリジル基、

2-ピリジルオキシ基、

カルバゾリル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基、

フェニル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基、」から選ばれる基の1又は2個で置換されたフェニル基、

アミノ基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、

アニリノ基、

N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該フェニル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

ベンジルアミノ基、

N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

モルホリノ基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、

ペルヒドロアゾシン-1-イル基、

ペルヒドロアゼピン-1-イル基、

2-オキソピロリジン-1-イル基、

4-カルボキシピペリジノカルボニル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキルアミノ基、

アジリジン-1-イル基、

1-C₁₋₆アルキル-2-オキソピペラジン-4-イル基、

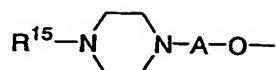
「カルボキシル基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イル-カルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル基、ピロリジン-

1-イル-メチル基、モルホリノメチル基又はN,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基」で置換されたピペリジノ基、

イミダゾリン-2-オン-1-イル基又は

オキサゾリジン-1-イル基である。] で表される基又は

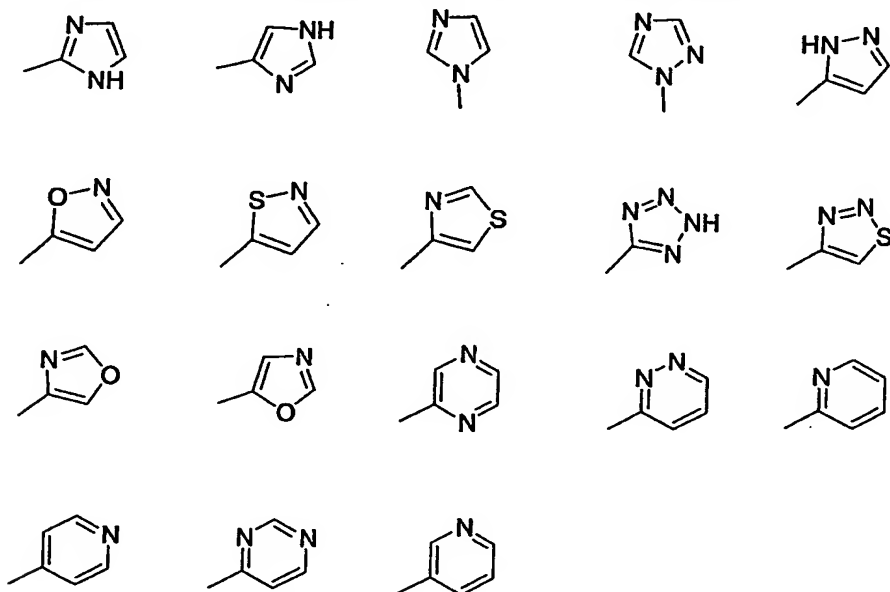
式



(式中、A及び R^{15} は前記と同意義である。)で表される基である。)

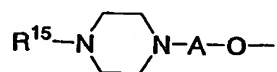
で表されるアゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩である。

本発明において、 R^1 で示されるヘテロ環基としては、例えば下記式で示される基、 C_{1-4} アルキル基で置換された下記式で示される基などが挙げられる。



好ましくは、ピラゾール-3-イル基、イソオキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、ピラジンを2-イル基、及びこれらが C_{1-4} アルキル基で置換された基である。

また、本発明において、 R^3 、 R^{13} 、 R^{23} 、 R^{33} で示される基としては、式



(式中、A及び R^{15} は前記と同意義である)で示される基が好ましい。

本発明において使用される用語が以下に定義される。

本発明において、「 C_{x-y} 」とは、その後に続く基が $x \sim y$ 個の炭素原子を有することを意味する。

ハロゲン原子は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好ましくはフッ素原子、塩素原子又は臭素原子であり、より好ましくはフッ素原子又は塩素原子である。

C_{1-4} アルキル基及び C_{1-6} アルキル基は、炭素原子をそれぞれ1～4個、1～6個有する直鎖状又は分枝状のアルキル基を意味し、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、*n*-ヘキシル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、イソペンチル基、イソヘキシル基、2,2-ジメチルブチル基、3,3-ジメチルブチル基などが挙げられる。

C_{1-10} アルコキシ基は、炭素原子を1～10個有する直鎖状又は分枝状のアルコキシ基を意味し、 C_{1-8} アルコキシ基が好ましい。 C_{1-8} アルコキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2-プロペニルオキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ヘキシルオキシ基、ヘプチルオキシ基などが挙げられる。

C_{3-14} アルコキシ基は、炭素原子を3～14個有する直鎖状又は分枝状のアルコキシ基を意味し、例えば、プロポキシ基、イソプロポキシ基、2-プロペニルオキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、ヘキシルオキシ基、ヘプチルオキシ基などが挙げられる。

C_{2-14} アルカノイル基は、炭素原子を1～13個有する直鎖状又は分枝状のアルキル基と1個のカルボニル基(—CO—)が複合した形態を有するものであり、 C_{2-7} アルカノイル基が好ましい。 C_{2-7} アルカノイル基としては、例えば、アセチル基、プロピオニル基、*n*-ブチリル基、イソブチリル基、ピバロイル基、*n*-ペンタノイル基、4-メチルペンタノイル基、2-エチルブチリル基、3,3-ジメチルブチリル基、*n*-ヘキサノイル基、*n*-ヘプタノイル基などが挙げられる。

1～6個のハロゲン原子で置換された C_{2-14} アルコキシ基は、1～6個のハロゲン原子で置換された炭素原子を2～14個有する直鎖状又は分枝状のアルコキシ基であり、例えば、2,2,2-トリフルオロエチル基、4,4,4-トリフルオロブトキシ基などが挙げられる。

1～6個のハロゲン原子で置換された C_{2-6} アルカノイル基は、1～6個のハ

ロゲン原子で置換された C_{1-5} アルキル基と1個のカルボニル基($-CO-$)が複合した形態を有するものであり、 C_{2-4} アルカノイル基が好ましい。それらとして、例えば、4,4,4-トリフルオロプロチリル基などが挙げられる。

C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基は、 C_{1-6} アルコキシ基と C_{1-6} アルコキシ基が複合した形態を有するものであり、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルコキシ基が好ましい。中でも、メトキシエトキシ基、エトキシエトキシ基、 n -ブトキシエトキシ基、イソブトキシエトキシ基などがより好ましい。

C_{2-6} アルコキシカルボニル基は、炭素原子を1~5個有する直鎖状又は分枝状のアルコキシ基と1個のカルボニル基($-CO-$)が複合した形態を有するものであり、 C_{2-4} アルコキシカルボニル基が好ましい。中でも、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、4-tert-ブトキシカルボニル基などがより好ましい。

C_{1-6} アルコキシ C_{2-6} アルカノイル基は、 C_{1-6} アルコキシ基と C_{2-6} アルカノイル基が複合した形態を有するものであり、例えば、2-メトキシアセチル基などが挙げられる。

C_{3-10} シクロアルキル基は、炭素原子を3~10個有する環状アルキル基を意味し、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基などが挙げられる。中でも、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が好ましい。

C_{1-6} アルキル基で置換された C_{3-10} シクロアルキル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子が C_{1-6} アルキル基、好ましくは C_{1-4} アルキル基によって置換された C_{3-10} シクロアルキル基であり、例えば1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基などが挙げられる。

C_{3-10} シクロアルコキシ基は、炭素原子を3~10個有する環状アルコキシ基を意味し、例えば、シクロプロポキシ基、シクロブトキシ基、シクロペントキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シクロオクチルオキシ基などが挙げられる。中でも、シクロプロポキシ基、シクロブトキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基が好ましい。

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基は、C₃₋₈シクロアルキル基とC₁₋₆アルキル基が複合した形態を有するものであり、C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキル基が好ましい。C₃₋₆シクロアルキルC₁₋₃アルキル基として、例えば、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基などが挙げられる。

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基は、C₃₋₈シクロアルキル基と1個のカルボニル基(—CO—)が複合した形態を有するものであり、C₃₋₆シクロアルキルカルボニル基が好ましい。C₃₋₆シクロアルキルカルボニル基として、例えば、シクロプロピルカルボニル基、シクロブチルカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基などが挙げられる。

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基は、N,N-ジメチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基などが好ましい。

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基は、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基とC₁₋₄アルキル基が複合した形態を有するものであり、例えば、N,N-ジメチルアミノメチル基、N,N-ジメチルアミノエチル基などが挙げられる。

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基は、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基とC₁₋₆アルコキシ基が複合した形態を有するものであり、例えば、N,N-ジメチルアミノエトキシ基、N,N-ジエチルアミノエトキシ基などが挙げられる。

C₂₋₁₀アルケニルオキシ基は、少なくとも1つの二重結合及び炭素原子を2～10個有する直鎖状又は分枝状のアルケニルオキシ基を意味し、例えば、エテニルオキシ基、プロペニルオキシ基、ブテニルオキシ基、2-メチルブテニルオキシ基、3-メチルブテニルオキシ基、2-メチル-2-ブテニルオキシ基、ペンテニルオキシ基、2-メチル-2-ペンテニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基、ヘプテニルオキシ基、オクテニルオキシ基などが挙げられる。

C₂₋₁₄アルキニルオキシ基は、少なくとも1つの三重結合及び炭素原子を2～14個有する直鎖状又は分枝状のアルキニルオキシ基を意味し、例えば、エチニルオキシ基、プロピニルオキシ基、ブチニルオキシ基、ペンチニルオキシ基、ヘキセニルオキシ基、ヘプチニルオキシ基、オクチニルオキシ基、ペント-2-エ

ン-4-イニルオキシ基などが挙げられる。

C₄₋₁₀シクロアルケニル基は、炭素原子を4～10個有する環状アルケニル基を示し、例えば、シクロプロテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、などが挙げられる。

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基によって置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基であり、例えば3-メチルシクロヘキセン-4-イル基などが挙げられる。

オキセタニル基は、ヘテロ原子として酸素原子を1個有する飽和四員環の形態を有するもので、オキセタン-2-イル基、オキセタン-3-イル基などが挙げられる。

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基によって置換されたオキセタニル基であり、例えば3-メチルオキセタン-3-イル基などが挙げられる。

オキシソラニル基は、ヘテロ原子として酸素原子を1個有する飽和五員環の形態を有するもので、2-オキシソラニル基、3-オキシソラニル基等が挙げられる。

ジオキシソラニル基は、ヘテロ原子として酸素原子を2個有する飽和五員環（ジオキシソラン）、好ましくは1,3-ジオキシソランの環から水素を除いて誘導される1価の基を意味する。

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキシソラニル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基によって置換されたジオキシソラニル基であり、例えば2,2-ジメチル-1,3-ジオキシソラン-4-イル基などが挙げられる。

オキサニル基は、ヘテロ原子として酸素原子を1個有する飽和六員環の形態を有するもので、2-オキサニル基、3-オキサニル基、4-オキサニル基を含む。

ジオキサニル基は、ヘテロ原子として酸素原子を2個有する飽和六員環（ジオキサン）、例えば1,3-ジオキサンの環から水素を除いて誘導される1価の基を意味する。

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキサニル基は、その基の環がC₁₋₆アルキル基で置換されていてもよく、例えば5,5-ジメチル-1,3-ジオキサニル-2-イル基などである。

フリル基は、2-フリル基、3-フリル基を含む。

チエニル基は、2-チエニル基、3-チエニル基を含む。

C₁₋₆アルキルチオ基は、炭素原子を1~6個有する直鎖状又は分枝状のアルキル基と1個のチオ基(-S-)が複合した形態を有しており、C₁₋₄アルキルチオ基が好ましい。例えば、メチルチオ基、エチルチオ基などが挙げられる。

ピロリジニル基は、ピロリジンの窒素原子又は炭素原子上から水素原子を除いて誘導される1価の基を意味し、例えば、1-ピロリジニル基、2-ピロリジニル基、3-ピロリジニル基などが挙げられる。

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基によって置換されたピロリジニル基であり、例えば、N-メチルピロリジン-2-イル基などが挙げられる。

ピペリジル基は、ピペリジンの炭素原子上から水素原子を除いて誘導される1価の基を意味する。

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基は、その基の水素原子がC₁₋₆アルキル基によって置換されたピペリジル基であり、例えば、N-メチルピペリジン-2-イル基、N-メチルピペリジン-3-イル基などが挙げられる。

ピペリジノ基は、ピペリジンの窒素原子上から水素原子を除いて誘導される1価の基を意味する。

「カルボキシル基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イル-カルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル基、ピロリジン-1-イル-メチル基、モルホリノメチル基又はN,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基」で置換されたピペリジノ基は、ピペリジンの炭素原子上の少なくとも1つの水素原子がカルボキシル基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イル-カルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル

基、ピロリジン-1-イル-メチル基、モルホリノメチル基又はN,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基で置換されたものを意味し、例えば、4-カルボキシピペリジノ基、4-(モルホリノカルボニル)ピペリジノ基、4-(ピロリジン-1-イル-カルボニル)ピペリジノ基、4-(ピペリジノカルボニル)ピペリジノ基、4-(N,N-ジエチルカルバモイル)ピペリジノ基、4-(ピペリジノメチル)ピペリジノ基、4-(ピロリジン-1-イル-メチル)ピペリジノ基、4-(モルホリノメチル)ピペリジノ基、4-(N,N-ジエチルアミノメチル)ピペリジノ基などが挙げられる。

モルホリノ基は、モルホリンの窒素原子上から水素原子を除いて誘導される1価の基を意味する。

C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基は、その基上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基によって置換されたモルホリノ基であり、3,5-ジメチルモルホリノ基などが挙げられる。

チアゾリル基は、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、を含む。

C₁₋₆アルキル基で置換されたチアゾリル基は、その環上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、好ましくはC₁₋₄アルキル基、より好ましくはメチル基によって置換されたチアゾリル基であり、例えば4-メチルチアゾール-5-イル基などが挙げられる。

オキサゾリル基は、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基が好ましい。

ピリジル基は、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基を含み、好ましくは2-ピリジル基、3-ピリジル基である。

「C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基及びピペリジノメチル基」から選ばれる基で置換されたピリジル基は、ピリジン環上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基又はピペリジノメチル基によって置換されたピリジル基であり、

例えば2-メチルピリジン-5-イル基、2-メチルピリジン-6-イル基、5-エトキシカルボニルピリジン-2-イル基、5-ヒドロキシエチルピリジン-2-イル基、5-(エトキシカルボニルピペラジノメチル)ピリジン-2-イル基などが挙げられる。

ピロリル基は、1-ピロリル基、2-ピロリル基、3-ピロリル基を含み、1-ピロリル基が好ましい。

「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基」から選ばれる基で置換されたフェニル基は、フェニル基の1~3個の水素原子が、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基から選ばれる任意の基によって置換されたフェニル基である。中でも、メチル基、メトキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基及びメチルチオ基から選ばれる任意の基によって置換されたフェニル基が好ましい。それらは、例えば、3-メチルフェニル基、3,4-ジメチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2-プロモフェニル基、4-フルオロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル基などが挙げられる。

C_{1-6} アルキル基で置換されたカルバモイル基は、カルバモイル基の窒素原子上の少なくとも1つの水素原子が C_{1-6} アルキル基によって置換された基を意味し、 C_{2-5} アルキル基によって置換されたカルバモイル基が好ましい。 C_{2-5} アルキル基によって置換されたカルバモイル基として、例えば、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ヘキシルカルバモイル基が挙げられる。

C_{3-8} シクロアルキル基で置換されたカルバモイル基は、カルバモイル基の窒素原子上の少なくとも1つの水素原子が C_{3-8} シクロアルキル基によって置換された基を意味し、 C_{5-6} シクロアルキル基によって置換されたカルバモイル基が好ましい。 C_{5-6} シクロアルキル基によって置換されたカルバモイル基として、例えば、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル

基が挙げられる。

C₁₋₆アルキルスルホニル基は、C₁₋₆アルキル基とスルホニル基(—SO₂—)が複合した形態を有するものであり、C₁₋₄アルキルスルホニル基が好ましい。C₁₋₄アルキルスルホニル基として、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、イソプロパンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基が挙げられる。

「1～6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基は、その基上の少なくとも1つの水素原子が、1～6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基の内いずれかで置換されたC₂₋₆アルカノイル基を意味する。例えば、4,4,4-トリフルオロブチリル基、2-メトキシアセチル、3-ピペリジノプロピオニル基、2-シアノアセチル基、3-(N,N-ジエチルアミノ)プロピオニル基、4-(N,N-ジメチルアミノ)ブチリル基、3-アセチルプロピオニル基、2-シクロプロピルアセチル基、2-シクロペンチルアセチル基、3-シクロペンチルプロピオニル基、2-シクロヘキシルアセチル基、2-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル)アセチル基、3-(4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル)プロピオニル基などが挙げられる。

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子」で置換されたベンジル基は、ベンゼン環上の少なくとも1つの水素原子がC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基若しくはハロゲン原子から選ばれる基で置換されてもよい。それらは、例えば、4-フルオロベンジル基、4-メトキシベンジル基、3-メチルベンジル基、3,4-ジメチルベンジル基、4-メトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、2-ブロモベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基などが挙げられる。

C₁₋₄アルキル基で置換されてもよいピラゾール-3-イル基、イソオキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、

1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、ピラジン-2-イル基とは、それらの基の一つの水素原子がC₁₋₄アルキル基で置換されてもよいことを意味する。これらとしては、例えば、1H-ピラゾール-3-イル基、2H-ピラゾール-3-イル基、1-メチルピラゾール-3-イル基、2-メチルピラゾール-3-イル基、4-メチルピラゾール-3-イル基、イソオキサゾール-5-イル基、3-メチルイソオキサゾール-5-イル基、4-メチルイソオキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-5-イル基、4-メチルイソチアゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、2-メチルイミダゾール-1-イル基、4-メチルイミダゾール-1-イル基、5-メチルイミダゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、ピラジン-2-イル基などが挙げられる。

Aで定義されるC₁₋₁₀アルキレン基は、炭素原子を1~10個有する直鎖状又は分枝状のアルキレン基を意味し、例えば、メチレン基、メチルメチレン基、エチレン基、プロピレン基、ヘプチレン基、2, 2-ジメチルプロピレン基、ヘキシレン基などが挙げられる。中でも、エチレン基が好ましい。

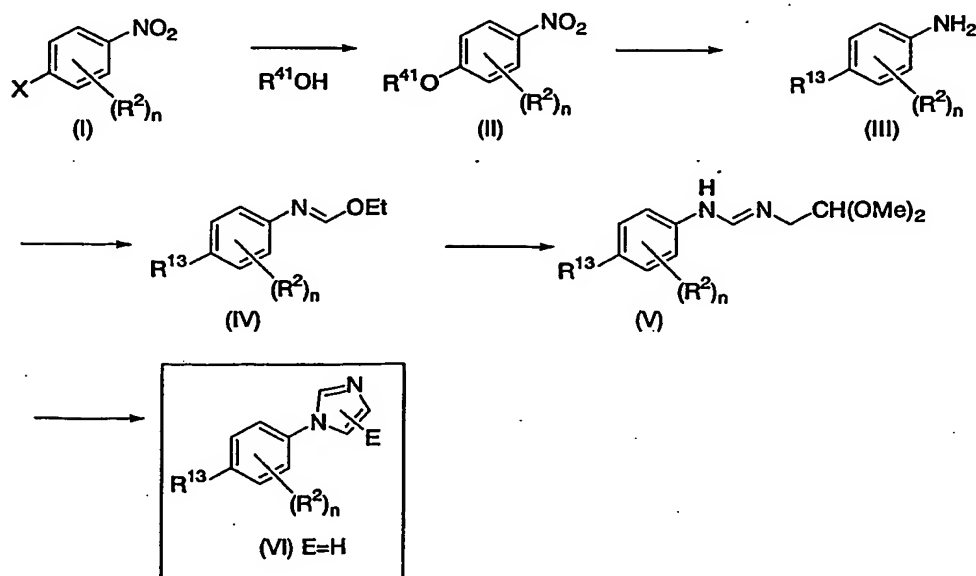
そして、上記した各種の基は、上記に挙げた置換された形態の他にも、その基上の少なくとも1つの水素原子が、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等のハロゲン原子、ニトロ基、アミノ基、ヒドロキシ基、チオール基、ホルミル基、カルボキシル基、シアノ基、カルバモイル基、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基等のアルキル基、フェニル基、ナフチル基、ビフェニル基、アントラニル基等のアリール基、ピロリル基、ピリジル基、チエニル基等の複素環基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル基、アセチル基、ベンゾイル基等のアシル基、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基等のアルコキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基等のアルキルチオ基、等の非水素原子又は基によって置換されていてもよい。なお、これらの置換基中の炭素原子数は、上記したx又はyには含まれない。

また、製薬学的に許容される塩とは、アルカリ金属類、アルカリ土類金属類、アンモニウム、アルキルアンモニウムなどとの塩、鉍酸又は有機酸との塩であり、

例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、アンモニウム塩、アルミニウム塩、トリエチルアンモニウム塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酪酸塩、ぎ酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、酒石酸塩、クエン酸塩、ステアリン酸塩、コハク酸塩、エチルコハク酸塩、ラクチオン酸塩、グルコン酸塩、グルコヘプトン酸塩、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、2-ヒドロキシエタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、ラウリル硫酸塩、リンゴ酸塩、アスパラギン酸塩、グルタミン酸塩、アジピン酸塩、システインとの塩、N-アセチルシステインとの塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、リン酸塩、硫酸塩、よう化水素酸塩、ニコチン酸塩、シュウ酸塩、ピクリン酸塩、チオシアン酸塩、ウンデカン酸塩、アクリル酸ポリマーとの塩、カルボキシビニルポリマーとの塩などを挙げるができる。

本発明の化合物は、以下に示す製造法によって合成することができる。(以下の反応式中、Y、 R^2 、 R^{13} 、E、nは前記と同意義であり、Xはフッ素、塩素等の脱離基であり、 X^1 は $B(OH)_2$ 又はハロゲン原子であり、 X^2 はハロゲン原子であり、 $R^{41}O$ は R^{13} で定義される各種のアルコキシ基である。)

製造法1 (イミダゾール-1-イル-フェニル誘導体の製造)



ニトロベンゼン誘導体 I を適当な溶媒中 (メタノール、エタノール、プロパノ

ール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド等) 必要に応じて塩基(トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等) の存在下、対応する種々のアルコール類と反応し化合物 II を製造することができる。この時反応温度は0℃～80℃、好ましくは0℃～室温で、反応時間は1～12時間、好ましくは1～2時間である。

次に、化合物 II を適当な溶媒(メタノール、エタノール、プロパノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル等) 中、還元剤(パラジウム活性炭/水素雰囲気下、パラジウム活性炭/ヒドラジン水和物、パラジウム活性炭/ギ酸アンモニウム、塩化スズ(II) 1水和物、鉄/塩化アンモニウム、ラネーニッケル/ヒドラジン水和物等、好ましくはパラジウム活性炭/水素雰囲気下) を用いてニトロ基を還元することでアニリン誘導体 III を製造することができる。反応温度は室温～150℃、好ましくは室温～100℃で、反応時間は1時間～24時間である。

次に、J. Heterocyclic Chem., 25 巻, 1649 項, 1988 年を参照にアニリン誘導体 III を酢酸又は塩酸等の酸触媒の存在下あるいは非存在下に、オルトギ酸トリメチル、オルトギ酸トリエチル等のオルトギ酸エステル類と反応させ、イミノエーテル誘導体 IV を得る。反応温度は室温から150℃、好ましくは70～100℃で反応時間は2～72時間である。

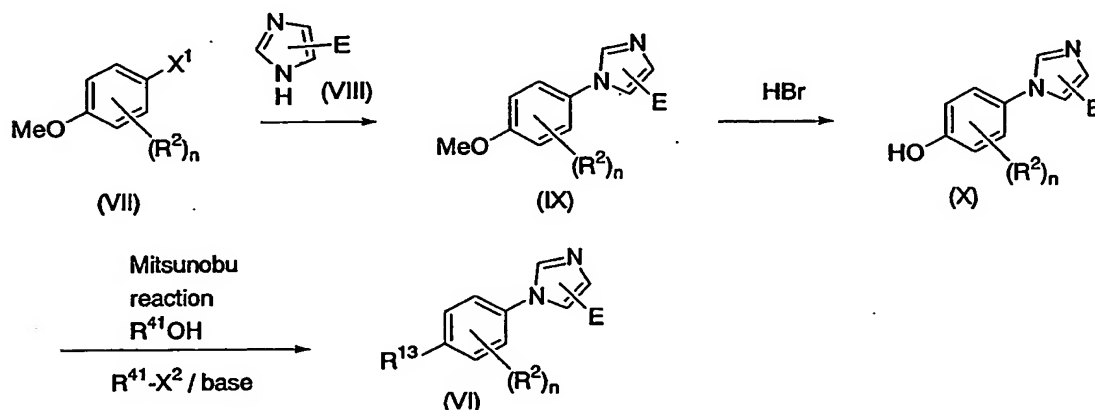
次に、イミノエーテル誘導体 IV を適当な溶媒中(メタノール、エタノール、プロパノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド等) アミノアセトアルデヒドジメチルアセタールと反応させホルムアミジン誘導体 V を得る。この時の反応温度は室温～150℃、好ましくは70～100℃であり、反応時間は2～24時間である。

次に、ホルムアミジン誘導体 V を適当な溶媒中(エーテル、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、ジオキサン等) にルイス酸あるいは酸触媒(四塩

化チタン、トリフルオロボランエーテラート、酢酸等)の共存下反応させ、本発明化合物 VI を合成することができる。

また、化合物 VI はアニリン誘導体 III から直接合成することもできる。すなわち、アニリン誘導体 III とアンモニア、ホルムアルデヒド、そしてグリオキサールを 1 : 1 : 1 : 1 の比率で混合し、水又はアルコール／水の混合溶媒中にて、反応温度は室温～150℃、好ましくは70～120℃で反応することによって本発明化合物 VI を合成することができる。

製造法 2 (イミダゾール-1-イルフェニル誘導体の製造)

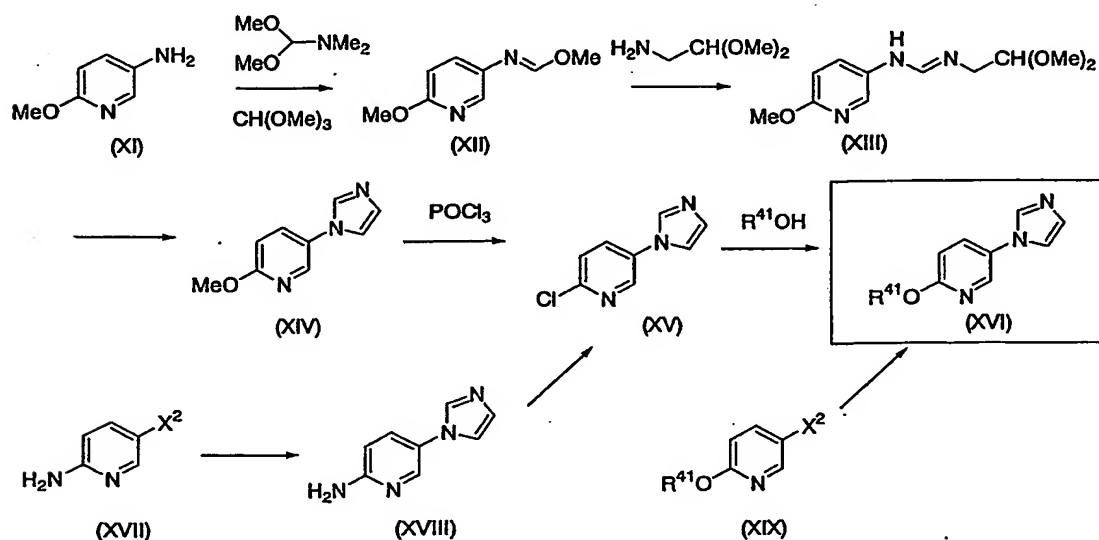


本発明化合物 VI は鍵中間体 X を経て以下の様にして製造することができる。フェニルボロン酸又はハロゲン化フェニル誘導体 VII を適当な溶媒(メタノール、エタノール、プロパノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド等)中、銅触媒([Cu(OH)TMEDA]₂Cl₂, (CuOTf)₂benzene 等)存在下、好ましくは酸素雰囲気下でイミダゾール誘導体 VIII と縮合し化合物 IX を製造することができる (Organic Lett., 第 2 巻, 1237 項, 2000 年)。反応温度は室温が好ましく、反応時間は 12～24 時間である。

次いで、化合物 IX を 48% 臭化水素中 100℃～150℃で反応し、4-(イミダゾール-1-イル)フェノール誘導体 X を製造することができる。反応時間は 12 時間～72 時間、好ましくは 12 時間～24 時間である。次に、化合物 X と

対応する種々のアルコールを用いて光延反応 (Org. Reactions, 第 42 巻, 第 335 項) を行うことによって製造することができる。すなわち、化合物 X を適当な溶媒 (テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド等) 中、ホスフィン試薬 (トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィンやジフェニル-2-ピリジルホスフィン等)、ジアゾ試薬 (ジエチルアゾジカルボキシレートやジ-tert-ブチルアゾジカルボキシレート等)、及び対応する種々のアルコール類とを、0℃～室温、好ましくは室温にて2～12時間反応し、本発明化合物 VI を製造することができる。あるいは、種々のハロゲン化アルキル類と、適当な溶媒 (アセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、エーテル等) 中、適当な塩基 (トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等) 存在下、0℃～室温、好ましくは室温にて2～24時間反応し、式中 R^{13} が置換アルコキシ基 $R^{41}O$ である本発明化合物 VI を製造することができる。

製造法 3 (3-イミダゾール-1-イル-ピリジン誘導体の製造)



化合物 XI を N,N-ジメチルホルムアミド ジメチルアセタールと適当な溶媒

の存在下若しくは非存在下、室温～150℃、好ましくはトルエン溶液中、加熱還流下、1～5時間反応する。次いで、ここで得られるイミノエーテル XII を、単離又は単離せずに、適当な溶媒（トルエン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メタノール等）中、アミノアセトアルデヒド ジメチルアセタール又はその塩酸塩で処理することにより、化合物 XIII を合成することができる。

あるいは、化合物 XI を触媒量の酸（酢酸等の有機酸、塩酸等の鉱酸、ピリジン塩酸塩等のアミン類の鉱酸塩等）の存在下又は非存在下、オルトギ酸エステル類（オルトギ酸トリメチル、オルトギ酸トリエチル等）と、室温～150℃、好ましくはトルエン溶液中、加熱還流下、1～5時間反応する。次いで、ここで得られる反応中間体 XII を上記と同様な方法で反応することにより、化合物 XIII を合成することができる。

次に、化合物 XIII を酸（四塩化チタン等のルイス酸あるいは酢酸等の有機酸等）存在下、適当な溶媒（トルエン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等）中、室温～150℃、好ましくは100℃で1～3時間反応して、化合物 XIV を合成することができる。

次に、化合物 XIV を Shiao らの方法（Synth. Commun., 第20巻, 2971項, 1990年）に従い、N,N-ジメチルホルムアミド中オキシ塩化リンを用い、100℃で6～24時間反応することにより、一連の誘導体合成に必要な鍵合成中間体である化合物 XV を合成することができる。

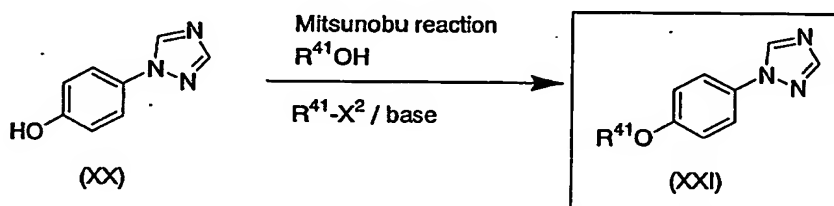
又は、別の方法でも化合物 XV を合成することができる。すなわち、化合物 XVII を、Ullman 型反応（Tetrahedron Lett., 第40巻, 2657項, 1999年）を用いて、キシレン等の適当な溶媒中、触媒量の $(\text{Cu(I)OTf})_2$, benzene、1,10-フェナンスロリン、ジベンジリデンアセトン及びイミダゾールと共に炭酸セシウム等の塩基の存在下、110～125℃で24～48時間反応することにより、化合物 XVIII を合成することができる。次に、化合物 XVIII を亜硝酸ナトリウム、塩化銅(II) 1水和物と水等の適当な溶媒中、室温又は氷冷下で1～6時間反応させて、化合物 XV を合成することができる。

次いで、化合物 XV を適当な溶媒（N,N-ジメチルホルムアミド、アセトン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等）中、適当な塩基（水素化ナトリウム、

炭酸カリウム、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等)の存在下、式 $R^{41}OH$ で表されるアルコール類と室温～150℃、好ましくは50～100℃で1～3時間反応させて、本発明化合物 XVI を合成することができる。

さらに、化合物 XIX をキシレン等の適当な溶媒中、触媒量の $(Cu(I)OTf)_2$, benzene, 1,10-フェナンスロリン、ジベンジリデンアセトン及びイミダゾールと共に炭酸セシウム等の塩基存在下、110～125℃で24～48時間反応することにより、本発明化合物 XVI を合成することができる。

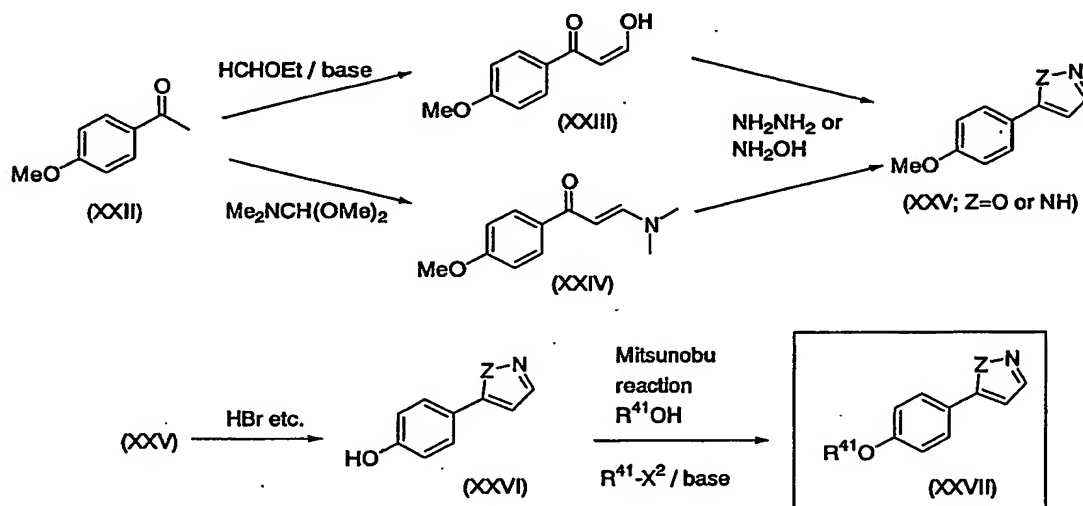
製造法4 (トリアゾール-1-イル-フェニル誘導体の製造)



4-(トリアゾール-1-イル)フェノール XX と対応する種々のアルコールを光延反応 (Org. Reactions, 第42巻, 第335項) を利用し製造することができる。すなわち、化合物 XX を適当な溶媒 (テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド等) 中、ホスフィン試薬 (トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィン、ジフェニル-2-ピリジルホスフィン等)、ジアゾ試薬 (ジエチルアゾジカルボキシレート、N,N,N',N'-テトラメチルアゾジカルボキサミド、ジ-tert-ブチルアゾジカルボキシレート等)、及び対応する種々のアルコール類 ($R^{41}OH$) と、0℃～室温、好ましくは室温にて2～12時間反応することによって、本発明化合物 XXI を製造することができる。あるいは、化合物 XX と種々のハロゲン化アルキル類と、適当な溶媒 (アセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、エーテル等) 中、適当な塩基 (トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリ

ウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等) 存在下、0℃～室温、好ましくは室温にて2～24時間反応し、本発明化合物XXIを製造することができる。

製造法5 (イソオキサゾール又はピラゾール誘導体の製造)



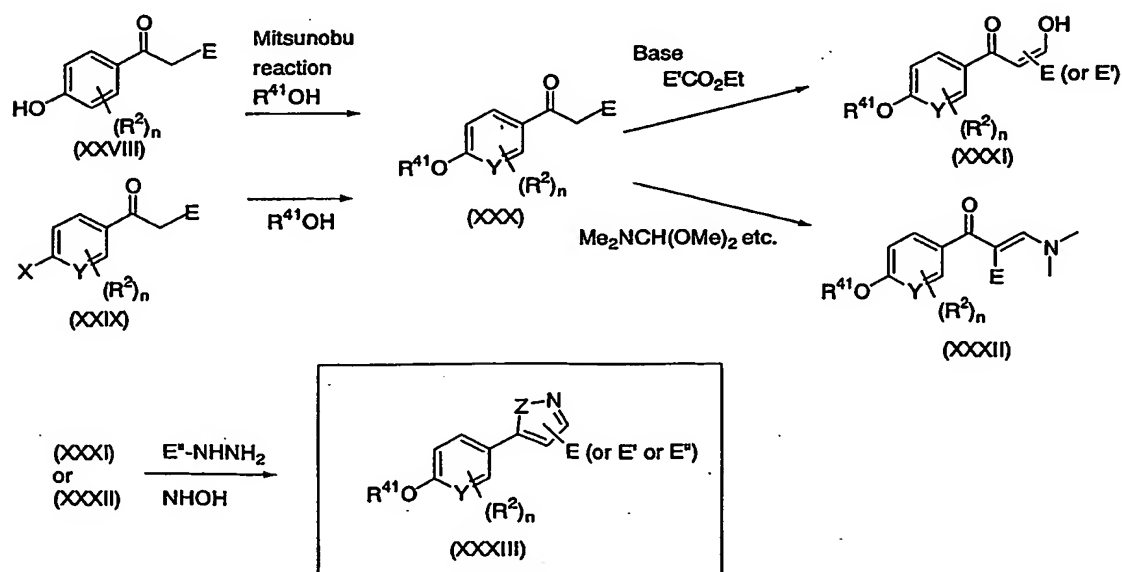
化合物XXIIをギ酸エチルと水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等の塩基存在下、適当な溶媒(テトラヒドロフラン、エーテル、メタノール等)中で、0℃～室温、好ましくは10℃～25℃で2時間反応してXXIIIを得る。また、化合物XXIIをN,N-ジメチルホルムアミド ジメチルアセタール中、室温から150℃、好ましくは還流温度で12～48時間反応して化合物XXIVを得る。

次に化合物XXIII又はXXIVを塩化ヒドロキシアニモニウム、塩化ヒドラジウム又はヒドラジン1水和物と、塩酸等の酸存在下若しくは非存在下、適当な溶媒(テトラヒドロフラン、メタノール、エタノール、水等)中、室温～100℃、好ましくは室温で1～3時間反応して化合物XXVを得る。化合物XXVを48%臭化水素中で還流加熱する。又は、三臭化ホウ素若しくは塩酸と適当な溶媒(ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、メタノール、エタノール等)中、室温～100℃、好ましくは室温～80℃で3～12時間反応して、鍵中間体XXVIを合成することができる。

成することができる。

次に光延反応を利用し、化合物 XXVII を合成することができる。すなわち、化合物 XXVI とトリフェニルホスフィンやジフェニル-2-ピリジルホスフィン等のホスフィン試薬、ジエチルアゾジカルボキシレートやジ-tert-ブチルアゾジカルボキシレート等の試薬及び対応する種々のアルコール類とを、適当な溶媒(テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド等)中、0℃～室温、好ましくは室温にて2～12時間反応し、化合物 XXVII (式中、ZはO又はNHである。)を合成することができる。あるいは、化合物 XXVI と種々のハロゲン化アルキル類 ($R^{41}-X^2$) と、適当な溶媒(アセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、エーテル等)中、適当な塩基(トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等)存在下、0℃～室温、好ましくは室温にて2～24時間反応し、本発明化合物 XXVII を製造することができる。

製造法6 (イソオキサゾール又はピラゾール誘導体の製造)



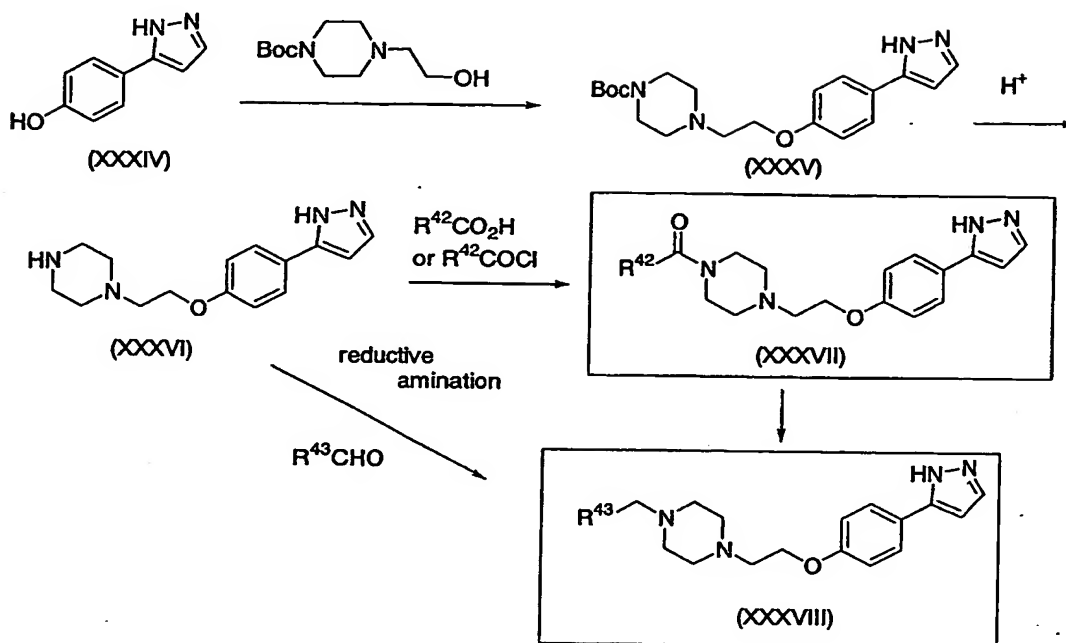
ベンゼン、ピリジン骨格又はヘテロ環に置換基を導入した化合物 XXXIII や前

記の化合物 XXVII を別の方法で製造することができる。すなわち、化合物 XXVIII から光延反応を利用し、化合物 XXX を得る。又は、化合物 XXIX と水酸化カリウム、tert-ブトキシカリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の適当な塩基存在下、対応する種々のアルコールとを、適当な溶媒（トルエン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、18-クラウン-6-エーテル存在下若しくは非存在下、0℃～100℃、好ましくは100℃にて2～12時間反応し、化合物 XXX を合成することができる。

次に化合物 XXX をぎ酸エチル、酢酸エチル等の低級アルキルエチルエステル ($E'CO_2Et$; 式中、 E' は水素原子又は C_{1-4} アルキル基を意味する。但し E 、 E' は同時に水素原子であるか、どちらか一方が C_{1-4} アルキル基である。) と水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等の塩基存在下、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、エーテル、メタノール等）中、0℃～室温、好ましくは10℃～25℃で2時間反応して化合物 XXXI を得る。また、化合物 XXX を N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール中、室温から150℃、好ましくは還流温度で12～48時間反応するか、tert-ブトキシビス(ジメチルアミノ)メタン中、室温～100℃、好ましくは90℃で2～3時間反応し、化合物 XXXII を得る。

化合物 XXXI 又は XXXII を塩化ヒドロキシルアンモニウム、塩化ヒドラジニウム、ヒドラジン1水和物又は $N-C_{1-4}$ アルキルヒドラジン ($E''NHNH_2$; 式中、 E'' は水素原子 C_{1-4} アルキル基を意味する。但し $E \sim E''$ は同時に水素原子であるか、いずれか一方が C_{1-4} アルキル基である。) とを、塩酸等の酸存在下若しくは非存在下、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、メタノール、エタノール、水等）中、室温～100℃、好ましくは室温で1～3時間反応して本発明化合物 XXXIII（を合成することができる。

製造法7 (ピラゾール誘導体の製造)



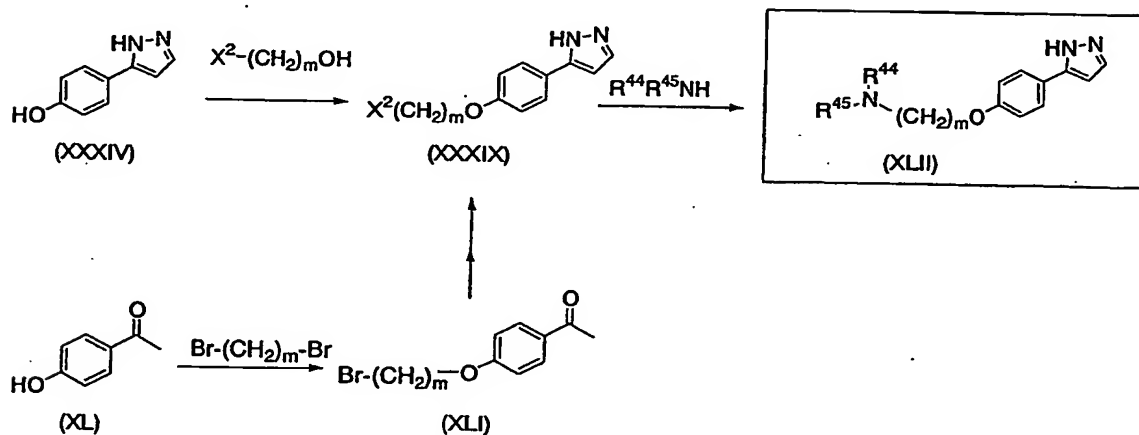
4-置換ピペラジーン-1-イル-エタノールを側鎖に有する化合物を以下のように製造することができる。まず、光延反応を利用し、化合物 XXXIV と N-Boc-ピペラジーンエタノールから化合物 XXXV を得る。これをトリフルオロ酢酸若しくは塩酸と適当な溶媒（ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、メタノール、エタノール等）中、室温～100℃、好ましくは室温で2～24時間、好ましくは2～4時間反応して、化合物 XXXVI を得る。

また、化合物 XXXVI とジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミド塩酸等の縮合剤、N-ヒドロキシスクシンイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール等の添加剤存在下若しくは非存在下、対応する種々のカルボン酸とを、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、0℃～100℃、好ましくは室温にて2～12時間反応し、化合物 XXXVII（式中、 R^{42} は隣接のカルボニル基とともに R^{15} で定義される基の一部を示す。）を合成することができる。また、化合物 XXXVI と種々の酸クロラ

イドを適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、0℃～100℃、好ましくは室温にて1～2時間反応し、化合物 XXXVII を合成することができる。

次に、化合物 XXXVII を水素化リチウムアルミニウム、ボラン・テトラヒドロフラン錯体等の適当な還元剤を用いて、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジクロロメタン等）中、0℃～70℃、好ましくは室温にて1～12時間反応し、化合物 XXXVIII（式中、 R^{43} は隣接のメチレン基とともに R^{15} で定義される基の一部を示す。）を合成することができる。また、化合物 XXXVI と NaBH_3CN 、 $\text{NaBH}(\text{OAc})_3$ 等の適当な還元剤と酢酸等の適当な酸存在下、種々のアルデヒドとを、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等）中、0℃～室温、好ましくは室温にて1～12時間反応し、化合物 XXXVIII を合成することができる。

製造法 8（ピラゾール誘導体の製造）

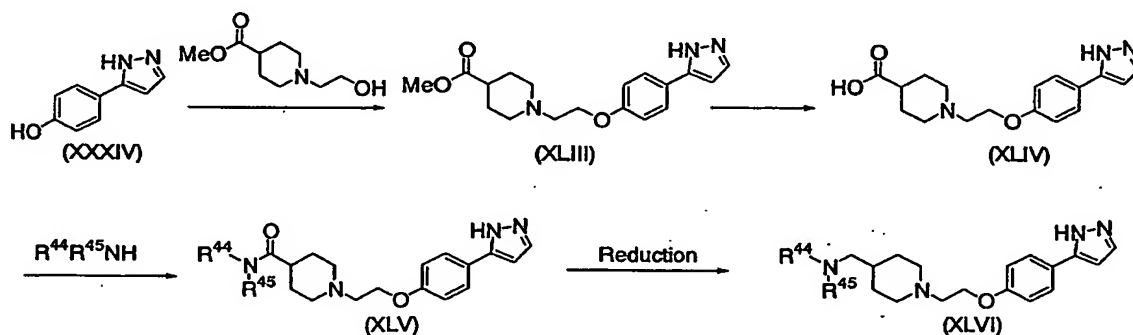


アミンとフェノール間のアルキレンの長さが異なった化合物 XLII を次のように合成することもできる。光延反応を利用し化合物 XXXIV とハロゲン化アルコール ($\text{X}^2-(\text{CH}_2)_m\text{OH}$; 式中、 m は1～10の整数である。)を縮合し化合物 XXXIX を得る。あるいは化合物 XL と水酸化ナトリウム、tert-ブトキシカリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の適当な塩基存在下、対応す

る種々のジブromoアルカンとを、適当な溶媒（水、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、テトラブチルアンモニウムスルホネート存在下若しくは非存在下、2～12時間反応し、化合物XLIを得る。この時の反応温度は0℃～100℃、好ましくは50℃である。

次に、化合物XLIから製造法5に記載した方法でピラゾール環を構築し、化合物XXXIXを製造することもできる。化合物XXXIXをtert-ブトキシカリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の適当な塩基存在下、対応する種々のアミンと、適当な溶媒（アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、0℃～150℃、好ましくは90℃にて2～12時間反応し、化合物XLII（式中、R⁴⁴及びR⁴⁵はそれぞれC₁₋₆アルキル基であるか又は隣接する窒素原子と一緒になって前記R³⁴で定義される基の一部を形成する基を示す。）を合成することができる。

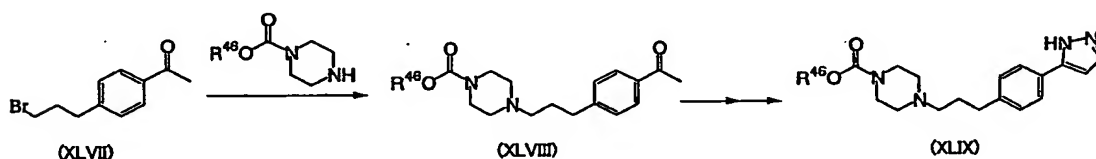
製造法9（ピラゾール誘導体の製造）



4-置換-ピペリジノエタノールを側鎖に有する化合物を以下のように製造することができる。まず、光延反応を利用し、化合物XXXIVと4-カルボメトキシピペリジノエタノールを縮合し化合物XLIIIを得る。これを水酸化ナトリウム、水酸化リチウム等の塩基存在下、水中、室温～100℃、好ましくは室温で1～12時間反応後、塩酸等の酸を用い中和して化合物XLIVを得る。化合物XLIVとジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、N-エチル-N'

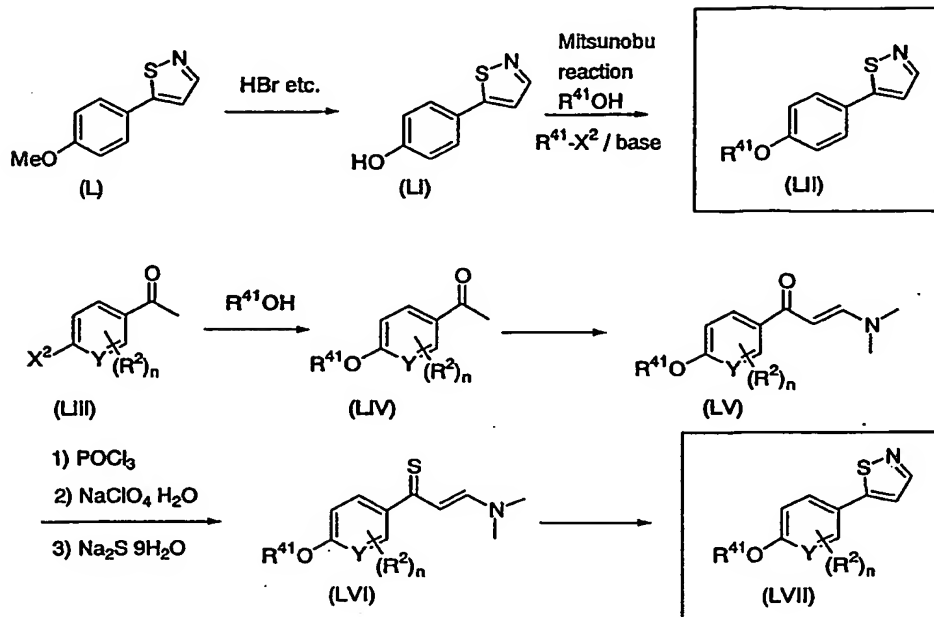
－3－ジメチルアミノプロピルカルボジイミド塩酸等の縮合剤、N－ヒドロキシスクシンイミド、1－ヒドロキシベンゾトリアゾール等の添加剤存在下若しくは非存在下、対応する種々のアミンとを、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N－ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、0℃～100℃、好ましくは室温にて2～12時間反応し、化合物 XLV を合成することができる。さらに、化合物 XLV と水素化リチウムアルミニウム、ボラン・テトラヒドロフラン錯体等の還元剤を、適当な溶媒（テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジクロロメタン等）中、0℃～70℃、好ましくは室温にて1～12時間反応し、化合物 XLVI を合成することができる。

製造法 10（ピラゾール誘導体の製造）



化合物 XLVII と 1－C₂₋₆アルコキシカルボニルピペラジン（式中、R^{4,6}OC₂₋₆はR^{1,5}で定義されるC₂₋₆アルコキシカルボニル基である。）を、炭酸セシウム存在下、N,N－ジメチルホルムアミド中、室温で12時間、50℃にて1時間反応し、化合物 XLVIII を得る。さらに、化合物 XLVIII から製造法5に記載した方法でピラゾール環を構築しフェノキシ部分が炭素に置き換わった化合物 XLIX を製造することができる。

製造法 11 (イソチアゾール誘導体の製造)



5-(4-メトキシフェニル)イソチアゾール L (J. Org. Chem., 第45巻, 4857項, 1980年) を 48% 臭化水素中で還流加熱する。又は、三臭化ホウ素若しくは塩酸と適当な溶媒 (ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、メタノール、エタノール等) 中、室温～100℃、好ましくは室温～80℃で3～12時間反応して、鍵中間体 LI を合成することができる。

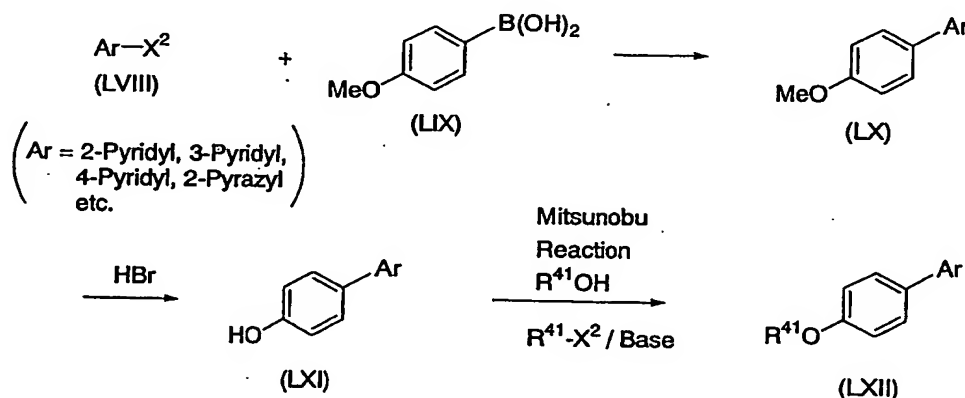
次に、製造法 5 に記載した方法と同様に光延反応を利用し化合物 LI と対応する種々のアルコール類とを縮合し、化合物 LII を合成することができる。あるいは、化合物 LI と種々のハロゲン化アルキル類と、適当な溶媒 (アセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、エーテル等) 中、適当な塩基 (トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等) 存在下、0℃～室温、好ましくは室温にて2～24時間反応し、本発明化合物 LII を製造することができる。

また、3-イソチアゾール-5-イル-ピリジン誘導体などは次のように合成

することができる。化合物 LIII と水酸化カリウム、tert-ブトキシカリウム、炭酸セシウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の適当な塩基存在下、対応する種々のアルコールとを、適当な溶媒（トルエン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等）中、18-クラウン-6-エーテル存在下若しくは非存在下、0℃～100℃、好ましくは100℃にて2～12時間反応し、化合物 LIV を合成することができる。

次に、これをN,N-ジメチルホルムアミド ジメチルアセタール中、室温から150℃、好ましくは還流温度で12～48時間反応するか、tert-ブトキシピス（ジメチルアミノ）メタン中、室温～100℃、好ましくは90℃で2～3時間反応し、化合物 LV を得る。次に、この化合物を文献（J. Org. Chem., 第45巻, 4857項, 1980年）記載の方法に従い、化合物 LVI を経由して目的とする化合物 LVII を製造することができる。

製造法 12（窒素原子を1～2個持つ複素6員環-フェニル誘導体の製造）



本発明化合物 LXII は鍵中間体 LXI を経て以下の様にして製造することができる。フェニルボロン酸誘導体 LIX とアリールハライド LVIII（式中、Ar はR¹で定義される6員環ヘテロ環基である。）とを、適当な溶媒（メタノール、エタノール、プロパノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン、トルエン、塩化メチレン、クロロホルム、アセトニトリル、酢酸エチル、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、1,2-ジメトキシエタン、水等）中、パラジウム触媒

(Pd(OAc)₂、PdCl₂(dppb)₂等)存在下、トリフェニルホスフィン存在下若しくは非存在下、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の塩基存在下、室温～120℃、好ましくは還流温度で1～24時間反応させ化合物 LX を得る。

次に、化合物 LX を48%臭化水素中、100℃～150℃で12～24時間反応し、鍵中間体 LXI を得る。化合物 LXI と対応する種々のアルコールを光延反応を利用し、本発明化合物 LXII を製造することができる。あるいは、種々のハロゲン化アルキル類と、適当な溶媒（アセトン、N,N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、エーテル等）中、適当な塩基（トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、tert-ブトキシカリウム等）存在下、0℃～室温、好ましくは室温にて2～24時間反応し、本発明化合物 LXII を製造することができる。

本発明に係る化合物は、経口又は非経口的に投与することができる。その投与剤型は錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、粉剤、トローチ剤、軟膏剤、クリーム剤、乳剤、懸濁剤、坐剤、注射剤等であり、いずれも慣用の製剤技術（例えば、第14改正日本薬局方に規定する方法等）によって製造することができる。これらの投与剤型は、患者の症状、年齢及び治療の目的に応じて適宜選択することができる。各種剤型の製剤の製造においては、常用の賦形剤（例えば、結晶セルロース、デンプン、乳糖、マンニトール等）、結合剤（例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン等）、滑沢剤（例えば、ステアリン酸マグネシウム、タルク等）、崩壊剤（例えば、カルボキシメチルセルロースカルシウム等）などを用いることができる。

本発明に係る化合物の投与量は、成人を治療する場合で1日1～2000mgであり、これを1日1回又は数回に分けて投与する。この投与量は、患者の年齢、体重及び症状によって適宜増減することができる。

発明を実施するための最良の形態

以下、実施例を挙げて本発明をさらに詳しく説明する。

実施例 1

2-メトキシ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (化合物 1) の製造

2-メトキシ-5-アミノピリジン (30.0 g, 0.242 mol) をトルエン (150 ml) に溶解し、オルトギ酸エチル (97 ml, 0.580 mol) を加えて還流下、3 時間撹拌した。原料消失を確認した後、2-アミノアセトアルデヒドジメチルアセタール (52 ml, 0.483 mol) を加えて室温にて 1 晩撹拌した。反応終了後、減圧濃縮して得られた褐色油状物質を 1,2-ジメトキシエタン (60 ml) に溶解した。氷冷下 1.0 M-四塩化チタン/トルエン溶液 (300 ml, 0.300 mol) を滴下し、100℃にて 3 時間撹拌した後、氷冷下、5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した不溶物をセライトで濾過し、不溶物を酢酸エチルで洗浄した。濾液の水層を酢酸エチルで 2 回抽出し、有機層とあわせて飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧濃縮して得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製し、標題化合物 (20.5 g) を黄色固体として得た。

融点 84.0 ~ 88.0℃

実施例 2

2-(2,2-ジメチルプロポキシ)-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (化合物 11) の製造

(1) 実施例 1 で合成した 2-メトキシ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (20.5 g, 0.117 mol) を N,N-ジメチルホルムアミド (400 ml) に溶解し、氷冷下、オキシ塩化リン (35 ml, 0.374 mol) を滴下した後、100℃にて 6 時間撹拌した。反応終了後、5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和し、減圧濃縮した。残査を酢酸エチルで希釈し、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル = 2:1) で精製し、2-クロロ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (9.42 g) を黄色固体として得た。

(2) 水素化ナトリウム (60% oil, 17 mg, 0.425 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 懸濁液に、2,2-ジメチル-1-プロパノール (37 mg, 0.418 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 溶液を滴下して室温にて撹拌した。発泡がおさまっ

た後、2-クロロ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (25 mg, 0.139 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 溶液を加えて還流下、3時間撹拌した。溶媒を留去後、蒸留水 (0.2 ml) を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣を陽イオン交換シリカゲルカラムクロマトグラフィーに移して、メタノールで溶出した。さらに1M-アンモニア/メタノールで溶出し、目的物を含む画分を減圧濃縮した。残渣をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で精製し、標題化合物 (26 mg) を無色固体として得た。

融点 87.0～91.0℃

実施例3

2-[3-(N,N-ジプロピルアミノ)-2,2-ジメチルプロポキシ]-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン（化合物110）の合成

水素化ナトリウム (60% oil, 17 mg, 0.425 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 懸濁液に、2,2-ジメチル-3-(N,N-ジプロピルアミノ)-1-プロパノール (72 mg, 0.418 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 溶液を滴下して室温にて撹拌した。発泡がおさまった後、2-クロロ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン (25 mg, 0.139 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2 ml) 溶液を加えて還流下、3時間撹拌した。Merrifield 樹脂 (140 mg) を加え室温にて1晩撹拌した。樹脂を濾過し、濾液を減圧濃縮した後、蒸留水 (0.2 ml) を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝2：1）で精製して標題化合物 (4.8 mg) を無色固体として得た。

融点 115.0～121.0℃

実施例4

2-[2-(N,N-ジメチルアミノ)エトキシ]-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン（化合物95）の合成

水素化ナトリウム (60% oil, 17 mg, 0.425 mmol) のテトラヒドロフラン (0.2

ml) 懸濁液に、2-(N,N-ジメチルアミノ)-1-エタノール(37.2 mg, 0.418 mmol)のテトラヒドロフラン(1.2 ml)溶液を滴下して室温にて攪拌した。発泡がおさまった後、2-クロロ-5-イミダゾール-1-イル-ピリジン(150 mg, 0.835 mmol)のテトラヒドロフラン(0.2 ml)溶液を加えて還流下、3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、蒸留水(0.2 ml)を加え、酢酸エチルで3回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=2：1)で精製して標題化合物(29.5 mg)を黄色油状物質として得た。

実施例 5

1-(4-プロピルフェニル)イミダゾール 塩酸 (化合物 618) の製造

4-プロピルアニリン(2.03 g, 0.0150 mol)とオルトギ酸トリエチル(4.99 g, 0.0337 mol)の混合物を100℃で7時間攪拌した。室温に冷却した後、反応液にメタノール(15 ml)とアミノアセトアルデヒドジメチルアセタール(5.69 g, 0.0541 mol)を加え、室温にて30分間攪拌し、さらに100℃で4時間攪拌した。室温に冷却後、反応液を濃縮して得られた残査に1,2-ジメトキシエタン(20 ml)と1M-四塩化チタン/トルエン溶液(21 ml, 0.021 mol)を加え、室温にて1時間、さらに加熱還流下、4時間攪拌した。室温に冷却後、反応液に水酸化ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム：メタノール=97：3)で精製し、1-(4-プロピルフェニル)イミダゾール (2.0 g)を褐色油状物として得た。生成物に4M-塩酸/酢酸エチル溶液を加え、酢酸エチル-クロロホルムの混合溶媒から再結晶し、無色粉末状の標題化合物(1.38 g)を得た。

融点155.5~157.0℃

実施例 6

{2-[2-(4-イミダゾール-1-イル-フェノキシ)エトキシ]エチル}ジメチルアミン 2塩酸 (化合物 626) の製造

(1) 水素化ナトリウム (60% oil, 1.0 g, 0.026 mol) の N,N-ジメチルホルムアミド (3.0 ml) 懸濁液に氷冷下、N,N-ジメチルアミノエトキシエタノール (3.46 g, 0.026 mol) の N,N-ジメチルホルムアミド (5 ml) 溶液を滴下し、10 分間攪拌した。この反応混合物に 4-フルオロニトロベンゼン (3.00 g, 0.021 mol) の N,N-ジメチルホルムアミド (10 ml) 溶液を滴下し、室温にて 2 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮して、ジメチル-〔2-〔2-(4-ニトロフェノキシ)エトキシ〕エチル〕アミン (5.90 g) を得た。

(2) 上記で得た化合物をメタノール (100 ml) に溶解し、10%パラジウム-活性炭 (0.60 g) を加え、水素雰囲気下、室温にて 3 時間攪拌した。TLC 分析により原料の消失を確認した後に、セライトを用いて不溶物を濾過し、濾液を濃縮してアニリン誘導体 (5.00 g) を褐色油状物質として得た。

(3) 次に、このアニリン誘導体にオルトギ酸トリエチル (10 ml, 0.060 mol) を加えて 100℃ で 20 時間攪拌した。室温に冷却した後に、反応液にメタノール (80 ml) とアミノアセトアルデヒドジメチルアセタール (6.8 ml, 0.063 mol) を加え、100℃ で 1.5 時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残査にジメトキシエタン (30 ml) と 1M-四塩化チタン/トルエン溶液 (25 ml, 0.025 mol) を加え、加熱還流下、5 時間攪拌した。室温に冷却した後に、反応液に水酸化ナトリウム水溶液を加えた。析出した不溶物を濾過後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査を NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=1:2) で精製し、〔2-〔2-(4-イミダゾール-1-イル-フェノキシ)エトキシ〕エチル〕ジメチルアミン (0.40 g) を油状物質として得た。生成物をジエチルエーテルに溶解し、4M-塩酸/酢酸エチル溶液を加え、減圧濃縮して析出した粉末を酢酸エチルで洗い、標題化合物 (0.428 g) を淡褐色粉末として得た。

融点 174.0 ~ 179.0℃

実施例 7

1-(4-プロポキシフェニル)イミダゾール トルエンシルホネート (化合物

604) の製造

4-(イミダゾール-1-イル)フェノール (1.0 g, 6.25 mmol)、プロパノール (563 mg, 9.38 mmol)、トリフェニルホスフィン (2.46 g, 9.38 mmol) 及びテトラヒドロフラン (20 ml) の混合物にジエチルアゾジカルボキシレート (1.48 ml, 9.38 mmol) を加え、室温にて6時間攪拌した。反応混合物を濃縮した後に、酢酸エチル (40 ml) を加え、1 M-塩酸水溶液 (20 ml) で抽出した。水層を5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和した後に、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 2) で精製し、1-(4-プロポキシフェニル)イミダゾール (1.17 g) を無色油状物質として得た。

これをエタノールに溶解し、p-トルエンスルホン酸 1 水和物 (1.10 g, 5.78 mmol) のエタノール溶液を加え、析出した結晶を濾過し、無色粉末状の標題化合物 (1.98 g) を得た。

融点 148.0 ~ 150.0 °C

実施例 8

1-(4-プロポキシフェニル)-2-メチルイミダゾール トルエンスルホンエート (化合物 627) の製造。

(1) 4-メトキシフェニルボレート (3.70 g, 24.4 mmol) と 2-メチルイミダゾール (1.00 g, 12.2 mmol)、塩化メチレン溶液 (48 ml) の混合物に、 $[\text{Cu}(\text{OH})\text{TMEDA}]_2\text{Cl}_2$ (0.57 g, 1.22 mmol) を加え、酸素雰囲気下、室温にて18時間攪拌した。反応混合物を濾過して不溶物を除いた後、濾液を減圧濃縮した。得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 4 : 1) で精製し、1-(4-メトキシフェニル)-2-メチルイミダゾール (2.35 g) を得た。

(2) 1-(4-メトキシフェニル)-2-メチルイミダゾール (2.00 g) と 48% 臭化水素 (20 ml) の混合物を 100 °C で 16 時間反応した。反応液を室温に冷却した後に、6 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和後、析出した結晶を濾過し、

4-(2-メチル-イミダゾール-1-イル)フェノール(0.75 g)を得た。

(3) 4-(2-メチル-イミダゾール-1-イル)フェノール(0.20 g, 1.2 mmol)とN,N-ジメチルホルムアミド溶液(2 ml)に、1-イオド-n-ブタン(0.25 g, 1.38 mmol)と炭酸カリウム(0.19 g, 1.38 mmol)を加え、室温で64時間攪拌した。反応液に水を加え、ヘキサン：酢酸エチル=1：1の混合溶媒で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4：1）で精製し、1-(4-ブトキシフェニル)-2-メチル-イミダゾール(0.17 g)を得た。これをエタノールに溶解し、p-トルエンスルホン酸1水和物のエタノール溶液を加え、析出した結晶を濾過し、無色粉末状の標題化合物(0.18 g)を得た。

融点 148.0～149.0℃

実施例9

1-(4-シクロヘキシルメトキシフェニル)-1,2,4-トリアゾール(化合物695)の製造

4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノール(700 mg, 4.34 mmol)、シクロヘキシルメタノール(742 mg, 6.51 mmol)、トリフェニルホスフィン(1.70 g, 6.51 mmol)及びテトラヒドロフラン(25 ml)の混合物にジエチルアゾジカルボキシレート(1.00 ml, 6.51 mmol)を加え、室温にて4時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した後に、得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=4：1）で精製した。これをヘキサン-酢酸エチルの混合溶媒から再結晶し、無色粉末状の標題化合物(461 mg)を得た。

融点 80.0～83.0℃

実施例10

3-{3-[4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノキシ]プロピル}ピリジン(化合物719)の製造

4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノール(700 mg, 4.34 mmol)、

3-(ピリジン-3-イル)プロパノール(1.22 g, 4.34 mmol)、トリブチルホスフィン(1.1 ml, 4.34 mmol)及びテトラヒドロフラン(10 ml)の混合物に、N, N, N', N'-テトラメチルアゾジカルボキサミド(746 mg, 4.34 mmol)を加え、室温にて24時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮した後、得られた残査を酢酸エチルに溶解し、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、NHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=1：2)で精製した。さらに得られた油状物質を陽イオン交換シリカゲルカラムクロマトグラフィー(メタノール～1 M-アンモニア/メタノール溶液)にて精製した。これをヘキサン-クロロホルムの混合溶媒から再結晶し、無色粉末状の標題化合物(377 mg)を得た。

融点 81.0～83.0℃

実施例 11

5-(4-ブトキシフェニル)イソオキサゾール(化合物136)の合成

(1)水素化ナトリウム(60% oil, 4.87 g, 0.122 mol)のテトラヒドロフラン(50 ml)溶液に氷冷下、ギ酸エチル(15 ml, 0.244 mol)を加え、続いて1-(4-メトキシメトキシフェニル)エタノン(10.0 g, 0.0555 mol)のテトラヒドロフラン(60 ml)溶液を内温が20℃以下になるように1.5時間かけて滴下した。反応混合物を室温になるまで放置し、酢酸エチル(200 ml)を加えた。この混合物を、水(100 ml)で2回抽出し、合わせた水層を0℃に冷却した。この水溶液に、塩酸ヒドロキシルアミン(4.20 g, 60.9 mmol)とメタノール(60 ml)溶液を加え室温で1時間攪拌した。濃塩酸(10 ml)とメタノールを加え室温で一昼夜攪拌した後に、さらに80℃で2時間反応させた。反応混合物を室温に冷却した後に、メタノールをエバポレーターで除去し、得られた水溶液を酢酸エチルで2回抽出した。合わせた有機層を、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン：酢酸エチル=1：1)で精製し4-(5-イソオキサゾリル)フェノール(5.00 g)を橙色粉末として得た。

融点 192.0～194.0℃

(2) 4-(5-イソオキサゾリル)フェノール(20.0 mg, 0.124 mmol)とブタノール(23.0 mg, 0.310 mmol)のテトラヒドロフラン(0.5 ml)溶液に、ジフェニル-2-ピリジルホスフィン(81.6 mg, 0.310 mmol)とジ-tert-ブチルアゾジカルボキシレート(71.4 mg, 0.310 mmol)を加え、室温にて2時間反応した。反応液を減圧濃縮した後に、4M-塩酸/1,4-ジオキサン溶液(0.5 ml)を加え、室温にて12時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後に、4M-塩酸水溶液(0.3ml)を加え、これを酢酸エチルで3回抽出した。合わせた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標題化合物(16.9 mg)を無色結晶として得た。

融点44.0~46.0℃

実施例12

2-(4-イソオキサゾール-5-イル-フェノキシメチル)ピリジン(化合物222)の合成

2-ピリジンメタノール(11.3 mg, 0.104 mmol)と4-(5-イソオキサゾリル)フェノール(41.9 mg, 0.260 mmol)のテトラヒドロフラン(1 ml)溶液に、トリフェニルホスフィン(68.1 mg, 0.260 mmol)とジエチルアゾジカルボキシレート(45.2 mg, 0.260 mmol)を加え室温にて一昼夜攪拌した。反応液を直接陽イオン交換シリカゲルカラムクロマトグラフィーに移し、テトラヒドロフランで溶出した。さらに、1M-アンモニア/メタノール溶液で目的物を溶出した。目的物を含む画分を減圧濃縮した後に、NH型シリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し標題化合物(18.9 mg)を無色結晶として得た。

融点70.0~71.0℃

実施例13

5-[4-(2-ピロール-1-イル-エトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール(化合物378)の合成

(1) 水素化ナトリウム(60% oil, 10.0 g, 0.25 mol)のテトラヒドロフラン

(100 ml)溶液に氷冷下、ギ酸エチル(30.8 ml, 0.500 mol)を加え、続いて4'-メトキシアセトフェノン(18.8 g, 0.125 mol)のテトラヒドロフラン(60 ml)溶液を滴下した。反応液を室温にもどした後に、水浴中で1時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチル(100 ml)を加え、この混合物を水(100 ml)で2回抽出した。この水溶液にヒドラジン1水和物(22.5 g, 0.450 mol)を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル(100 ml)で2回抽出し、合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:2)で精製し5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール(9.7 g)を無色粉末として得た。

融点 124.0~126.0℃

(2) 47%臭化水素(50 ml)に5-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾール(9.66 g, 0.055 mol)を加え、80℃で一昼夜攪拌した。さらに、47%臭化水素(20 ml)を追加し、9時間還流加熱した。反応液を室温に冷却した後に氷に注ぎ、この混合液を5M-水酸化ナトリウム水溶液で中和した。生成した固体を濾過し、4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノール(7.63 g)を得た。

融点 174.5~176.0℃ (参照 J.Med.Chem., 第21巻, 1100頁, 1978年;
融点 165.0~168.0℃)

(3) 4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノール(96 mg, 0.6 mmol)、2-ピロール-1-イルエタノール(120 mg, 1.08 mmol)、トリフェニルホスフィン(315 mg, 1.2 mmol)及びテトラヒドロフラン(3.0 ml)の混合物にジエチルアゾジカルボキシレート(209 mg, 1.2 mmol)のテトラヒドロフラン(1.2 ml)溶液を加え、室温にて6時間攪拌した。反応混合物をそのままNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:4)にて精製し、酢酸エチル-ヘキサンにて再結晶して、標題化合物(75 mg)を無色粉末として得た。

融点 129.0~130.0℃

実施例 1.4

5-[4-(4-N,N-ジメチルアミノブトキシ)フェニル]-1H-ピラゾール(化合物383)の合成

(1) 水素化ナトリウム(60% oil, 1.74 g, 43.5 mmol)をヘキサン洗浄、真空乾燥後、窒素雰囲気下、N,N-ジメチルホルムアミド(20 ml)に懸濁し、これに4-N,N-ジメチルアミノブタノール(5.10 g, 43.5 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(9 ml)溶液を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応混合物に氷冷下、4'-フルオロアセトフェノン(2.00 g, 14.5 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(7.2 ml)溶液を滴下し、室温にて3時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1~1:1)にて精製し、4'-(4-N,N-ジメチルアミノブトキシ)アセトフェノン(2.03 g)を黄色油状物質として得た。

(2) 水素化ナトリウム(60% oil, 0.101 g, 2.54 mmol)をヘキサン洗浄、真空乾燥後、窒素雰囲気下、テトラヒドロフラン(1 ml)に懸濁した。これにギ酸エチル(0.378 g, 5.10 mmol)を加え、さらに4'-(4-N,N-ジメチルアミノブトキシ)アセトフェノン(0.30 g, 1.27 mmol)のテトラヒドロフラン(2 ml)溶液を滴下し、室温にて30分間攪拌した。反応混合物に0.5M-塩酸水溶液を加え、ジエチルエーテルで洗浄し、水層にヒドラジン1水和物(1.91 g, 38.1 mmol)を加え、室温にて30分間攪拌した。反応混合物に6M-水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた粗生成物をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)にて精製し、酢酸エチル-ヘキサンにて再結晶し、標題化合物(0.190 g)を無色粉末として得た

融点 76.0~78.0℃

実施例15

4,4,4-トリフルオロ-1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-イル)ブタン-1-オン2塩酸(化合物432)の合成

(1) tert-ブチル 4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-カルボキシレート(74.5 g, 0.20 mol)の塩化メチレ

ン(320 ml)溶液にトリフルオロ酢酸(150 ml, 1.9 mol)を加え、室温で一晩攪拌した。減圧濃縮後、氷冷しながら残渣に25%アンモニア水溶液を加えて中和した。クロロホルム-メタノール溶媒で3回抽出し、合わせた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた粗生成物をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=9:1)にて精製し、1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン(48.7 g)を淡黄色粉末として得た。

融点 148.0~151.0℃

(2) 4,4,4-トリフルオロ酢酸(0.12 g, 0.82 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(5 ml)溶液に、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミド塩酸(0.18 g, 0.96 mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール1水和物(0.13 g, 0.95 mmol)、1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン(0.21 g, 0.76 mmol)を加え、室温で一晩反応した。反応混合物に酢酸エチルを加えて、飽和食塩水で2回洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:4~酢酸エチル)にて精製し、4,4,4-トリフルオロ-1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-イル)ブタン-1-オン(0.182 g)を無色ガム状物質として得た。これを酢酸エチルに溶解させ、4M-塩酸/酢酸エチル溶液を加え、析出した結晶を濾過し、標題化合物(0.17 g)を無色粉末として得た。

融点 125.0~127.5℃

実施例 16

5-[4-(6-ピロリジン-1-イル-ヘキシロキシ)フェニル]-1H-ピラゾール2塩酸(化合物474)の合成

(1) 4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノール(1.0 g, 6.28 mmol)、6-ブロモヘキサノール(2.3 g, 12.6 mmol)、トリフェニルホスフィン(3.3 g, 12.6 mmol)とテトラヒドロフラン(20 ml)の混合物に、ジエチルアゾジカルボキシレート(2.2 g, 12.6 mmol)のテトラヒドロフラン溶液(10 ml)を滴下し、室温にて1時

間攪拌した。反応液を減圧濃縮して残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：2）で精製し、5-[4-(6-ブロモヘキシロキシ)フェニル]-1H-ピラゾール(1.1 g)を黄色固体として得た。

(2) 5-[4-(6-ブロモヘキシロキシ)フェニル]-1H-ピラゾール(300 mg, 0.928 mmol)をアセトニトリル(9 ml)に溶解し、ピロリジン(155 μ l, 1.86 mmol)及び炭酸カリウム(257 mg, 1.86 mmol)を加えて50℃にて1時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して残査に飽和食塩水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮後、得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：5）で精製した。得られた無色の液体をメタノールに溶解し、4M-塩酸／酢酸エチル溶液を加えて室温にて攪拌した。析出した固体を濾取し、標題化合物(180 mg)を無色固体として得た。

融点172.0～177.0℃

実施例17

4-(1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペリジン-4-イル-メチル)モルホリン3塩酸（化合物500）の合成

(1) 4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノール(10.0 g, 62.5 mmol)のテトラヒドロフラン(100 ml)溶液に、トリフェニルホスフィン(21.7 g, 82.7 mmol)、メチル 1-(2-ヒドロキシエチル)ピペリジン-4-カルボキシレート(15.5 g, 82.8 mmol)のテトラヒドロフラン(50 ml)溶液を加えた。反応液を0℃に冷却後、ジエチルアゾジカルボキシレート（40% トルエン溶液；36.1 g, 82.8 mmol）を加えた。室温まで昇温後、そのまま一晩攪拌し、反応液に酢酸エチルを加え、1M-塩酸水溶液で2回洗浄した。合わせた水層を炭酸水素ナトリウムで中和し、酢酸エチルで2回抽出し、合わせた有機層を無水硫酸マグネシウムを用い乾燥した。減圧濃縮後、得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝3：7）にて精製し、メチル 1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペリジン-4-カルボキシレート(10.7 g)を無色粉末として得た。

(2) メチル 1-〔2-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ〕エチル〕ピペリジン-4-カルボキシレート(0.43 g, 1.3 mmol)のメタノール(15 ml)溶液に、1N-水酸化ナトリウム水溶液(6.5 ml, 6.5 mmol)を加え、室温で一晩攪拌した。反応混合物を1M-塩酸水溶液を用いて中和し、減圧濃縮後、1-〔2-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ〕エチル〕ピペリジン-4-カルボキシリック アシッドの粗結晶を得た。これをN,N-ジメチルホルムアミド(10 ml)に溶解させ、N-エチル-N'-3-ジメチルアミノプロピルカルボジイミド1塩酸(0.30 g, 1.6 mmol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール1水和物(0.21 g, 1.6 mmol)、モルホリン(0.12 g, 1.4 mmol)を加え、室温で一晩反応した。反応混合物に酢酸エチルを加えて、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)にて精製し、モルホリン-4-イル-(1-〔2-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ〕エチル〕ピペリジン-4-イル)メタノン(0.26 g)を無色非晶物質として得た。

(3) 水素化リチウムアルミニウム(77 mg, 2.0 mmol)のテトラヒドロフラン(15 ml)懸濁液に、氷冷下、モルホリン-4-イル-(1-〔2-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ〕エチル〕ピペリジン-4-イル)メタノン(0.25 g, 0.64 mmol)のテトラヒドロフラン(10 ml)溶液をゆっくりと滴下した。室温まで昇温して、そのまま室温で一晩攪拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、セライトで濾過して不溶物を除いた後、濾液にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。得られた残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)にて精製し、4-(1-〔2-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ〕エチル〕ピペリジン-4-イル-メチル)モルホリン(0.21 g)を得た。これを酢酸エチルに溶解し、4M-塩酸/酢酸エチル溶液を加え、析出した結晶をメタノール-酢酸エチルから再結晶し、標題化合物(0.24 g)を無色粉末として得た。

融点 242.5~243.0℃

実施例 18

エチル 4-〔3-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェニル〕プロピル〕ピペラジン-1-カルボキシレート 2 塩酸 (化合物 492) の合成

(1) エチル ピペラジン-1-カルボキシレート (1.5 g, 9.6 mmol) の N,N-ジメチルホルムアミド (15 ml) 溶液に、炭酸セシウム (6.4 g, 19.6 mmol)、4'-(3-プロモプロピル)アセトフェノン (2.8 g, 11.7 mmol) の N,N-ジメチルホルムアミド (10 ml) 溶液を加え、室温で一晩攪拌し、50℃でさらに1時間反応した。酢酸エチルで洗浄しながら不溶物を濾過し、濾液に酢酸エチルを加え、飽和食塩水で2回洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮後、得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=1：4～酢酸エチル) にて精製し、エチル 4-〔3-(4-アセチルフェニル)プロピル〕ピペラジン-1-カルボキシレート (2.0 g) を黄色油状物質として得た。

(2) エチル 4-〔3-(4-アセチルフェニル)プロピル〕ピペラジン-1-カルボキシレート (0.73 g, 2.3 mmol) と tert-ブトキシビス(ジメチルアミノ)メタン (1.9 g, 11.0 mmol) を 90℃で1時間反応した。室温まで冷却後、反応混合物をそのまま NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=2：3～1：4) にて精製し、中間体である、エチル 4-〔3-〔4-(3-ジメチルアミノアクリロイル)フェニル〕プロピル〕ピペラジン-1-カルボキシレート (0.90 g) を得た。この中間体をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解し、ヒドラジン 1 水和物 (0.47 g, 9.3 mmol) を加え、室温で一晩、50℃で4時間反応した。室温まで冷却後、反応液に酢酸エチルを加え、飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮後、残査を NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=3：7) にて精製し、エチル 4-〔3-〔4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェニル〕プロピル〕ピペラジン-1-カルボキシレート (0.65 g) を淡黄色ガム状物質として得た。これを酢酸エチルに溶解し、4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、メタノール-酢酸エチルより再結晶して標題化合物 (0.75 g) を淡黄色粉末として得た。

融点 175.0～177.5℃

実施例 19

エチル 4-[2-(4-イソチアゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート塩酸 (化合物 751) の合成

(1) 5-(4-メトキシフェニル)イソチアゾール (5.00 g, 0.026 mol ; J. Org. Chem., 第 45 巻, 4857 項, 1980 年) と 48% 臭化水素 (35 ml) の溶液を、加熱還流下、12 時間攪拌した。室温に冷却した後、反応液を 5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和した。析出した結晶を濾過し、水で洗い、4-(5-イソチアゾリル)フェノール (3.08 g) を赤色結晶として得た。

(2) エチル 4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジーン-1-カルボキシレート (7.99 g, 39.5 mmol) のテトラヒドロフラン (80 ml) 溶液に、トリフェニルホスフィン (10.4 g, 39.5 mmol) とジエチルアゾジカルボキシレート (40% トルエン溶液 ; 17.2 ml, 39.5 mmol) を加え、10 分間攪拌した。反応液に 4-(5-イソチアゾリル)フェノール (2.8 g, 15.8 mmol) のテトラヒドロフラン溶液を加え、室温で 2 時間攪拌した。溶媒を減圧濃縮後、残渣を酢酸エチルに溶解させ、4 M-塩酸水溶液で 2 回洗浄した。水層を 5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残渣を NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1 ~ 1 : 1) により精製し、4-[2-(4-イソチアゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート (5.0 g) を無色油状物質として得た。4-[2-(4-イソチアゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート (5.0 g) の酢酸エチル溶液に 4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加え、析出した結晶を濾別し、標題化合物 (3.37 g) を無色結晶として得た。

融点 216.0 ~ 217.0 °C

実施例 20

エチル 4-[2-(4-ピラジーン-2-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート 2 塩酸 (化合物 743) の合成

(1) クロロピラジン (1.00 g, 8.7 mmol) のジメトキシエタン (10 ml) 溶液に

4-メトキシフェニルボレート (1.60 g, 10.6 mmol)、トリフェニルホスフィン (0.23 g, 0.88 mmol)、2 M-炭酸カリウム水溶液 (12 ml, 24 mmol) を加え、室温で30分攪拌した。Pd(OAc)₂ (0.05 g, 0.22 mmol) を加え、100℃で5時間反応した。室温まで冷却し、水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮後、残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=3：1～1：1) で精製し、2-(4-メトキシフェニル)ピラジン (1.57 g) を無色固体として得た。

(2) 2-(4-メトキシフェニル)ピラジン (1.50 g, 8.1 mmol) に48%臭酸 (15 ml) を加え、100℃で19時間反応した。室温まで冷却し、反応液を水酸化ナトリウム水溶液と炭酸水素ナトリウム水溶液で中和後、析出した結晶を濾取し、4-ピラジン-2-イルフェノール (1.06 g) を橙色結晶として得た。

(3) 4-ピラジン-2-イルフェノール (0.21 g, 1.2 mmol) のテトラヒドロフラン (15 ml) 溶液に、トリフェニルホスフィン (0.48 g, 1.8 mmol)、エチル 4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン-1-カルボキシレート (0.37 g, 1.8 mmol) を加え、氷冷下、ジエチルアゾジカルボキシレート (40% トルエン溶液；0.80 g, 1.8 mmol) を加えた。室温まで昇温し、そのまま12時間攪拌した。溶媒を濃縮後、残査を酢酸エチルに溶解させ、1 M-塩酸水溶液で2回洗浄した。水層を水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、濃縮した。残査をNHシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=2：1～1：1) により精製し、エチル 4-[2-(4-ピラジン-2-イルフェノキシ)エチル]ピペラジン-1-カルボキシレート (0.47 g) の粗結晶を得た。得られたエチル 4-[2-(4-ピラジン-2-イルフェノキシ)エチル]ピペラジン-1-カルボキシレートの酢酸エチル溶液に、4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、標題化合物 (0.34 g) を淡黄色粉末として得た。

融点 204.0～204.5℃ (dec.)

実施例 21

4-(4-ブトキシフェニル)オキサゾール (化合物 759) の合成

(1) 4'-ブトキシアセトフェノン(2.50 g, 13 mmol)のクロロホルム(75 ml)溶液を0℃に冷却し、臭素(2.75 g, 14.3 mmol)を滴下した。反応温度を室温に戻し、そのまま2時間反応した。反応液に飽和亜硫酸ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=19:1)で精製し、2-ブロモ-4'-ブトキシアセトフェノン(1.85 g)を淡黄色油状物質として得た。

(2) 2-ブロモ-4'-ブトキシアセトフェノン(0.20 g, 0.74 mmol)をホルムアミド(2.5 ml)中、180℃で1時間反応した。室温まで冷却後、水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=9:1)で精製し、標題化合物(0.091 g)を淡褐色結晶として得た。

融点52.0~52.5℃

実施例22

エチル 4-[2-(4-オキサゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジン-1-カルボキシレート2塩酸(化合物760)の合成

(1) 4'-メトキシアセトフェノン(5.00 g, 36.7 mmol)のメタノール(50 ml)溶液に、TOSMIC(8.6 g, 44.0 mmol)とナトリウムメトキシド(5.9 g, 110 mmol)を加え、2時間還流加熱した。水を加え、室温でそのまま3日間反応した。溶媒を減圧濃縮後、残査に水を加えて析出した結晶を濾過し、5-(4'-メトキシフェニル)オキサゾール(5.37 g)を淡黄色結晶として得た。

融点63.0~64.5℃

(2) 5-(4'-メトキシフェニル)オキサゾール(2.50 g)に47%臭酸(18 ml)を加え、105℃で16時間反応した。室温まで冷却し、反応液を氷-炭酸水素ナトリウム水溶液に注いだ。5M-水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧濃縮した。残査をクロロホルム-メタノール-酢酸エチルより再結晶し、4-オキサゾール-4-イル-フェノール(0.96 g)を茶色結晶として得た。

融点 235.0~236.0℃

(3) エチル 4-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジーン-1-カルボキシレート(0.75 g, 3.7 mmol)のテトラヒドロフラン(10 ml)溶液に、トリフェニルホスフィン(0.98 g, 3.7 mmol)とジエチルアゾジカルボキシレート(40% トルエン溶液; 1.6 ml, 3.7 mmol)を加え、10分間攪拌した。反応液に4-オキサゾール-4-イル-フェノール(0.30 g, 1.9 mmol)を加え、室温で一晩反応した。溶媒を濃縮後、残渣を酢酸エチルに溶解させ、4M-塩酸水溶液で2回洗浄した。水層を5M-水酸化ナトリウム水溶液で中和後、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。残渣をSephadex LH 20を用いてゲル濾過(メタノール)して、エチル 4-[2-(4-オキサゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート(0.78 g)を得た。得られたエチル 4-[2-(4-オキサゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]ピペラジーン-1-カルボキシレート(0.35 g, 1.0 mmol)の酢酸エチル溶液に4M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、標題化合物(0.33 g)を無色結晶として得た。

融点 195.0~197.0℃ (dec.)

実施例 23

1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジーン-1-イル)-ブタン-1-オン 2塩酸(化合物399)の合成

1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジーン(2.0 g, 7.3 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(25 ml)けん濁液に、氷冷下、ブチリルクロリド(0.86 g, 8.1 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(5 ml)溶液を滴下した。氷冷下、1時間攪拌した後に、反応液に2.5M-水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム:メタノール=92:8)で精製し、無色油状物(2.4 g)を得た。これをヘキサン-酢酸エチルの混合溶媒から結晶化し、1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジーン-1-イル)-ブタン-1-オンを

無色粉末(1.3g)として得た。これを酢酸エチル-メタノールの混合物に溶解し、4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、標題化合物(1.1 g)を無色粉末として得た。

融点 204.0 ~ 207.0 °C (dec.)

実施例 24

2-シクロプロピル-1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-イル)エタノン 2塩酸(化合物440)の合成

2-シクロプロピル酢酸(11 g, 0.11 mol)、1-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン(20 g, 0.73 mol)のN,N-ジメチルホルムアミド-テトラヒドロフラン混合溶液に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド(21 g, 0.11 mol)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール1水和物(15 g, 0.11 mol)を加え、室温で一晩反応した。析出した不溶物を濾過し、1 M-塩酸水溶液、つづいて酢酸エチルで洗浄した。ろ液を5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和し、混合物を酢酸エチルで2回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた粗結晶をメタノールにて洗浄し2-シクロプロピル-1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-イル)エタノンを無色粉末(12.5g)として得た。融点 161.0 ~ 163.5 °C

これを酢酸エチル-メタノールの混合物に溶解し、4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、標題化合物を無色粉末として得た。

融点 162.0 ~ 174.0 °C

実施例 25

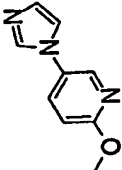
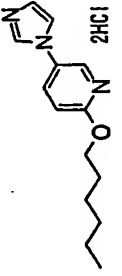
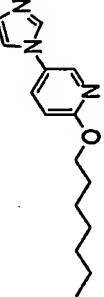
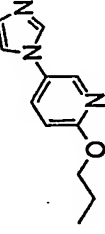
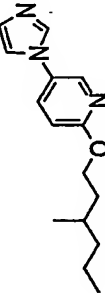
エチル 4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-カルボキシレート(化合物381)の合成

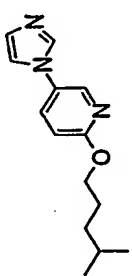
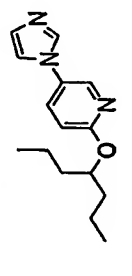
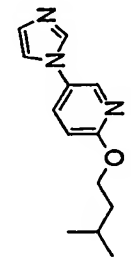
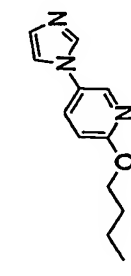
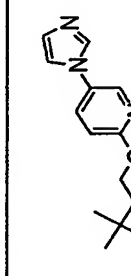
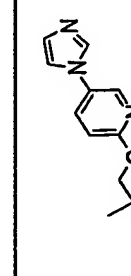
4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノール(5.0 g, 0.031 mol)、トリフェニルホスフィン(16.5g, 0.0628 mmol)、エチル 1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン-4-カルボキシレート(11.4 g, 0.0628 mmol)のテトラヒドロフラン

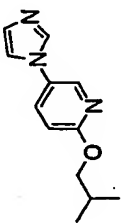
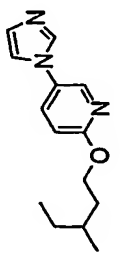
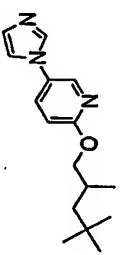
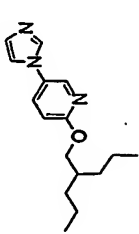
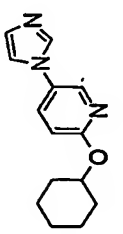
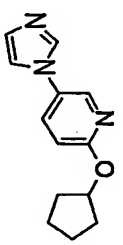
(150ml) 溶液に、ジエチルアゾジカルボキシレート (9.9 ml, 0.0628 mmol) を滴下した。室温にて 6 時間攪拌した後に、反応液を濃縮した。残査を 1 M-塩酸水溶液に溶解し、混合物をエーテルで洗浄した。水層を 5 M-水酸化ナトリウム水溶液で中和し、混合物を酢酸エチルで 2 回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残査を NH シリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1 : 5) にて精製し、エチル 4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}ピペラジン-1-カルボキシレートを無色油状物として得た。これを酢酸エチル-メタノールの混合物に溶解し、4 M-塩酸/酢酸エチル溶液を加えた。析出した結晶を濾別し、標題化合物を無色粉末 (10.5g) として得た。

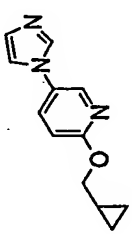
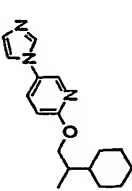
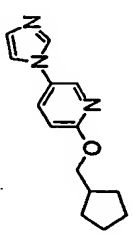
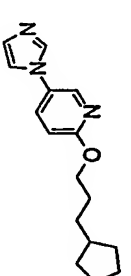
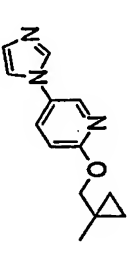
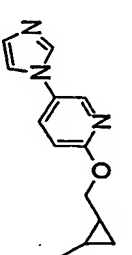
融点 217.0 ~ 218.0 °C (dec.)

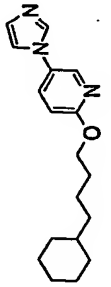
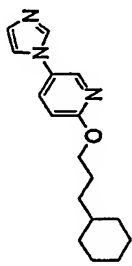
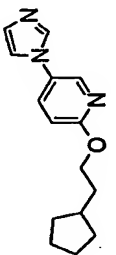
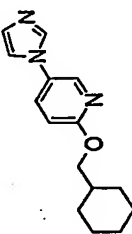
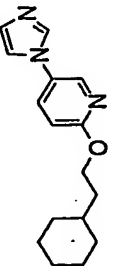
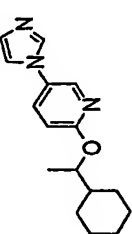
相当する出発原料と反応物を用い、上記実施例と同様な操作を行なうことにより、下記表に示す本発明化合物を得た。上記実施例で得た本発明化合物を合わせ表に示した。

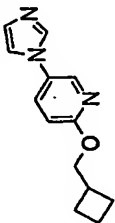
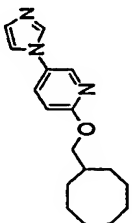
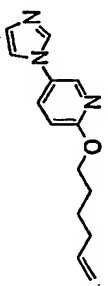
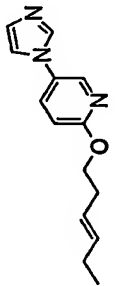
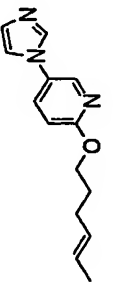
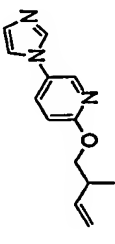
化合物番号	構造式	¹ H NMR(300MHz, CDCl ₃) spectra, mass spectra(APCI) and melting points	抑制率 % (at 0.1μM)	IC ₅₀ (nM)
化合物 1		δ 4.00 (s, 3H), 6.88 (d, J = 8.8Hz, 1H), 7.21 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 8.8, 2.8Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.26 (d, J = 2.8Hz, 1H).		
化合物 2		δ 0.88 (t, J = 6.8Hz, 3H), 1.22-1.48 (m, 6H), 1.67-1.81 (m, 2H), 4.33 (t, J = 6.8Hz, 2H), 7.08 (d, J = 9.0Hz), 7.93 (m, 1H), 8.15 (dd, J = 3.0, 9.0Hz, 1H), 8.23 (m, 1H), 8.61 (d, J = 3.0Hz, 1H), 9.66 (t, J = 1.3Hz, 1H).		7.7
化合物 3		δ 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.48-1.26 (m, 8H), 1.78 (m, 2H), 4.32 (t, J = 6.7Hz, 2H), 6.84 (dd, J = 8.7, 0.6Hz), 7.20 (d, J = 11.0Hz, 1H), 7.21 (d, J = 11.0Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.7, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	54.1	
化合物 4		δ 1.04 (t, J = 7.4, 3H), 1.82 (dt, J = 6.7, 7.4Hz, 2H), 4.29 (t, J = 6.7Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 204, M-H = 202.		
化合物 5		δ 0.90 (t, J = 6.0Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.4Hz, 3H), 1.15-1.41 (m, 3H), 1.53-1.79 (m, 3H), 1.82 (m, 1H), 4.36 (m, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	42.1	

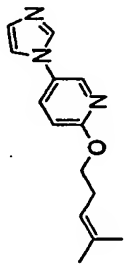
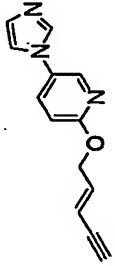
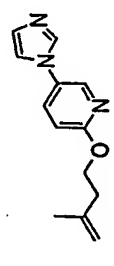
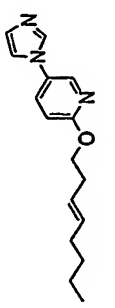
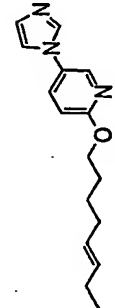
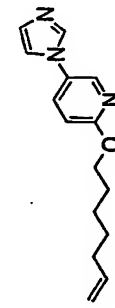
化合物 6		δ 0.92 (d, J = 6.7Hz, 6H), 1.35(m, 2H), 1.62 (m, 2H), 1.80 (m, 2H), 4.31 (t, J = 6.8Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	39.5	
化合物 7		M+H = 260, M-H = 258.	23.2	
化合物 8		δ 0.98 (d, J = 6.7Hz, 6H), 1.69 (dt, J = 6.7Hz, 2H), 1.82 (m, 1H), 4.35 (t, J = 6.7Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 232, M-H = 230.	12.2	
化合物 9		δ 0.99 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.48 (m, 2H), 1.78 (m, 2H), 4.34 (t, J = 6.7Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 218, M-H = 216.	31.1	
化合物 10		δ 1.01 (s, 9H), 1.73 (t, J = 7.5Hz, 2H), 4.40 (t, J = 7.5Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	33.9	
化合物 11		δ 1.05 (s, 9H), 4.01 (s, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 232, M-H = 230. mp 87.0-91.0 °C	14.5	

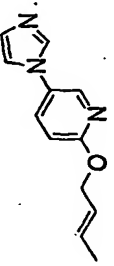
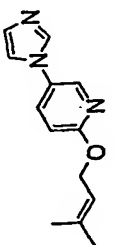
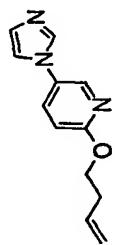
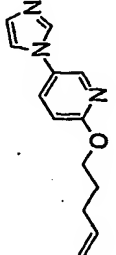
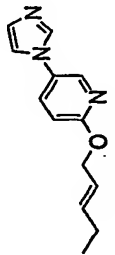
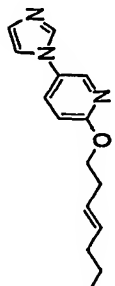
化合物 12		δ 1.03 (d, $J = 6.7$ Hz, 6H), 2.11 (ddt, $J = 6.7, 6.7$ Hz, 1H), 4.10 (d, $J = 6.7$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 218, M-H = 216.		
化合物 13		δ 0.89-0.97 (m, 6H), 1.26 (m, 1H), 1.43 (m, 1H), 1.61 (m, 2H), 1.83 (m, 1H), 4.36 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.		
化合物 14		δ 0.94 (s, 9H), 1.12 (dd, $J = 14.0, 6.0$ Hz, 1H), 1.40 (dd, $J = 14.0, 4.0$ Hz, 1H), 2.01 (m, 1H), 4.03 (dd, $J = 10.0, 7.5$ Hz, 1H), 4.17 (dd, $J = 10.0, 5.9$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 274, M-H = 272.		
化合物 15		δ 0.90-0.94 (m, 6H), 1.26-1.63 (m, 8H), 1.83 (m, 1H), 4.21 (d, $J = 5.8$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 274, M-H = 272.	99.1	
化合物 16		δ 1.63-1.75 (m, 2H), 1.79-1.85 (m, 4H), 1.96-2.01 (m, 2H), 5.42 (m, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	83.5	
化合物 17		δ 1.26-1.57 (m, 6H), 1.79-1.83 (m, 2H), 2.00-2.05 (m, 2H), 5.05 (m, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	44.4	

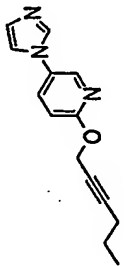
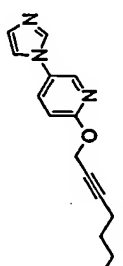
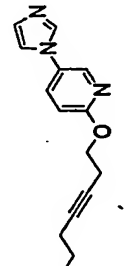
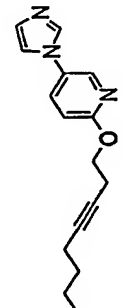
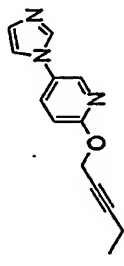
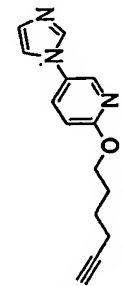
化合物 18		δ 0.37 (m, 2H), 0.65 (m, 2H), 1.31 (m, 1H), 4.18 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 216, M-H = 214.	30.0	
化合物 19		δ 0.99 (d, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.04-1.29 (m, 6H), 1.69-1.86 (m, 6H), 4.13 (dd, $J = 10.3, 7.2$ Hz, 1H), 4.31 (dd, $J = 10.3, 5.8$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 286, M-H = 284.	56.2	
化合物 20		δ 1.31-1.43 (m, 2H), 1.55-1.69 (m, 4H), 1.79-1.87 (m, 2H), 2.38 (m, 1H), 4.20 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	74.0	
化合物 21		δ 1.10-1.14 (m, 2H), 1.42-1.67 (m, 7H), 1.74-1.86 (m, 4H), 4.32 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	115.5	
化合物 22		δ 0.44 (m, 2H), 0.57 (m, 2H), 1.24 (s, 3H), 4.13 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	32.6	
化合物 23		δ 0.36 (ddd, $J = 8.2, 5.0, 5.0$ Hz, 1H), 0.54 (m, 1H), 0.80 (m, 1H), 1.00 (m, 1H), 1.10 (d, $J = 6.0$ Hz, 3H), 4.13 (dd, $J = 11.2, 7.2$ Hz, 1H), 4.21 (dd, $J = 11.2, 7.2$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	61.6	

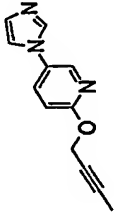
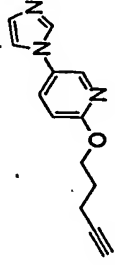
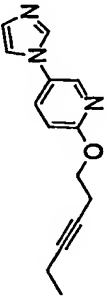
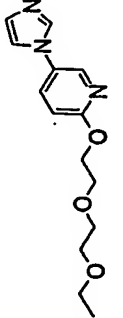
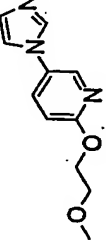
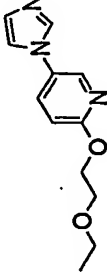
化合物 24		δ 0.89 (m, 2H), 1.11-1.29 (m, 6H), 1.41-1.51 (m, 2H), 1.62-1.82 (m, 7H), 4.32 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 300, M-H = 298.	54.2	
化合物 25		M+H = 286, M-H = 284.		
化合物 26		δ 1.15-1.26 (m, 2H), 1.51-1.70 (m, 4H), 1.80-2.02 (m, 5H), 4.35 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 258, M-H = 256.		
化合物 27		δ 1.01-1.12 (m, 2H), 1.19-1.37 (m, 3H), 1.69-1.88 (m, 6H), 4.14 (d, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	50.2	
化合物 28		δ 0.93-1.04 (m, 2H), 1.15-1.32 (m, 3H), 1.49 (m, 1H), 1.66-1.80 (m, 7H), 4.36 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	88.1	
化合物 29		δ 1.03-1.26 (m, 5H), 1.29 (d, $J = 6.4\text{Hz}$, 3H), 1.56-1.90 (m, 6H), 5.05 (dq, $J = 6.4, 6.4\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	53.0	

化合物 30		δ 1.85-2.02 (m, 4H), 2.15 (m, 2H), 2.79 (m, 1H), 4.31 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	39.6	
化合物 31		δ 1.38-1.81 (m, 14H), 2.04 (m, 1H), 4.10 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 286, M-H = 264.	64.0	
化合物 32		δ 1.52-1.62 (m, 2H), 1.82 (m, 2H), 2.14 (m, 2H), 4.34 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 4.95-5.08 (m, 2H), 5.84 (ddt, $J = 17.0, 10.3, 6.7\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	63.5	
化合物 33		δ 0.98 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.04 (m, 2H), 2.50 (m, 2H), 4.34 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 5.50 (m, 1H), 5.60 (m, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	57.4	
化合物 34		δ 1.66 (m, 3H), 1.85 (dt, $J = 7.6, 6.7\text{Hz}$, 2H), 2.16 (m, 2H), 4.35 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 5.49 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	36.6	
化合物 35		δ 1.15 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 3H), 2.71 (m, 1H), 4.20 (dd, $J = 10.4, 6.8\text{Hz}$, 1H), 4.26 (dd, $J = 10.4, 6.8\text{Hz}$, 1H), 5.06-5.17 (m, 2H), 5.87 (ddd, $J = 17.0, 10.4, 7.0\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	36.3	

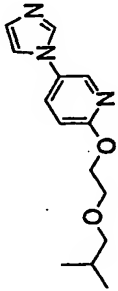
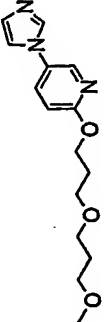
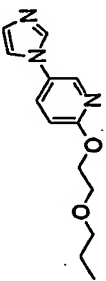
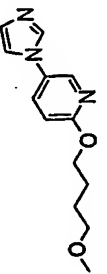
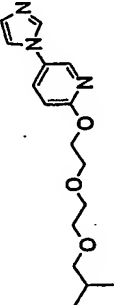
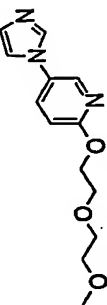
化合物 36		δ 1.67 (s, 3H), 1.73 (s, 3H), 2.49 (dt, $J = 7.0, 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.31 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 5.22 (m, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	50.7	
化合物 37		M+H = 226, M-H = 224.		
化合物 38		δ 1.82 (m, 3H), 2.52 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.47 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.81 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 230, M-H = 228.		
化合物 39		δ 1.35 (m, 3H), 1.26-1.40 (m, 4H), 2.08 (dt, $J = 6.8, 6.8\text{Hz}$, 2H), 2.55 (dt, $J = 6.8, 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.34 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 5.42-5.59 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	84.0	
化合物 40		δ 0.97 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 1.47-1.57 (m, 2H), 1.76-1.86 (m, 2H), 2.01-2.16 (m, 4H), 4.34 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 5.32-5.45 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	110.4	
化合物 41		δ 1.46-1.53 (m, 6H), 1.81 (m, 2H), 2.09 (m, 2H), 4.33 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 4.93-5.05 (m, 2H), 5.82 (ddt, $J = 16.8, 10.1, 6.7\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	82.1	

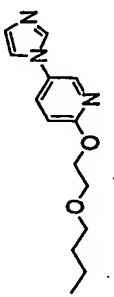
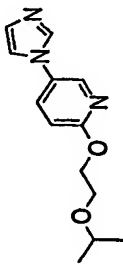
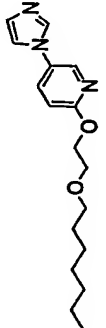
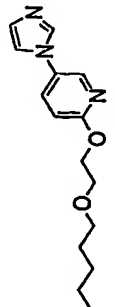
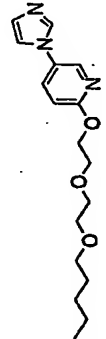
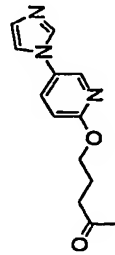
化合物 42		δ 1.77 (m, 3H), 4.81 (m, 2H), 5.73–5.96 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 216, M-H = 214.	59.1	
化合物 43		δ 1.78 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 4.86 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 5.53 (t, $J = 7.2$ Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	48.6	
化合物 44		δ 2.56 (ddt, $J = 13.4$, 6.7, 1.4Hz, 2H), 4.40 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 5.09–5.21 (m, 2H), 5.90 (ddt, $J = 16.9$, 9.8, 6.7Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 216, M-H = 214.	39.4	
化合物 45		δ 1.90 (tt, $J = 6.8$, 6.4Hz, 2H), 2.24 (dt, $J = 7.9$, 7.0Hz, 2H), 4.35 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.99–5.11 (m, 2H), 5.87 (ddt, $J = 16.9$, 10.5, 6.8Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	67.2	
化合物 46		δ 1.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.20 (m, 2H), 4.92 (dd, $J = 3.4$, 2.0Hz, 2H), 5.65–5.72 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	55.9	
化合物 47		δ 0.92 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.40 (ta, $J = 7.3$, 7.3Hz, 2H), 2.07 (dt, $J = 7.3$, 6.8Hz, 2H), 2.56 (dt, $J = 7.0$, 6.2Hz, 2H), 4.34 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 5.46–5.56 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	70.6	

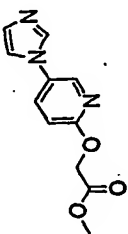
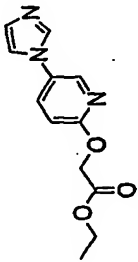
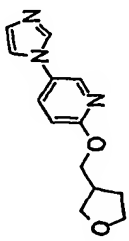
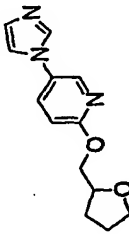
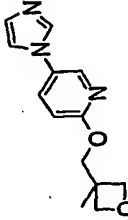
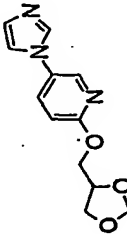
化合物 48		δ 0.98 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 1.56 (tq, $J = 7.3$, 7.1Hz, 2H), 2.23 (tt, $J = 7.1$, 2.2Hz, 2H), 5.00 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240.	36.1	
化合物 49		δ 0.98 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 1.50-1.64 (m, 4H), 2.25 (tt, $J = 7.1$, 2.2Hz, 2H), 5.00 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 256, M-H = 254.		
化合物 50		δ 0.97 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.51 (tq, $J = 7.2$, 7.2Hz, 2H), 2.14 (tt, $J = 7.2$, 2.3Hz, 2H), 2.67 (tt, $J = 7.0$, 2.3Hz, 2H), 4.43 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 256, M-H = 254.		
化合物 51		δ 0.91 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 1.26-1.49 (m, 4H), 2.16 (tt, $J = 2.3$, 2.3Hz, 2H), 2.66 (tt, $J = 7.1$, 2.3Hz, 2H), 4.43 (t, $J = 7.1\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 270, M-H = 268.	10.8	
化合物 52		δ 1.17 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.27 (tq, $J = 7.5$, 2.2Hz, 2H), 5.00 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 228, M-H = 226.	16.0	
化合物 53		δ 1.77 (m, 2H), 1.88-1.98 (m, 3H), 2.29 (m, 2H), 4.36 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240.	67.5	

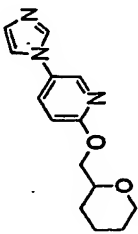
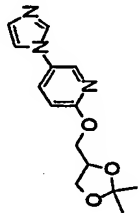
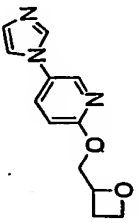
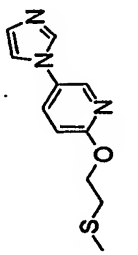
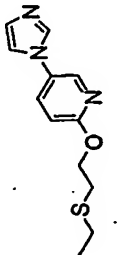
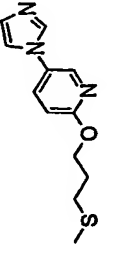
化合物 54		δ 1.89 (t, $J = 2.3$ Hz, 3H), 4.98 (q, $J = 2.3$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 214, M-H = 212.	32.3	
化合物 55		M+H = 228, M-H = 226.	20.3	
化合物 56		δ 1.13 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.18 (m, 2H), 2.67 (tt, $J = 7.0, 2.3$ Hz, 2H), 4.43 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240.	26.7	
化合物 57		δ 1.22 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 3.54 (q, $J = 7.0$ Hz, 2H), 3.63 (m, 2H), 3.72 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.53 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 278, M-H = 276.	8.9	
化合物 58		δ 3.46 (s, 3H), 3.77 (m, 2H), 4.52 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 220, M-H = 218.	5.9	
化合物 59		δ 1.25 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.83 (m, 2H), 4.52 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 234, M-H = 232.		

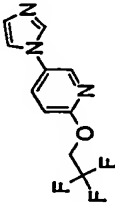
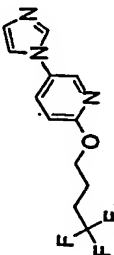
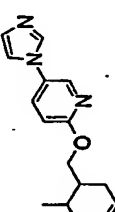
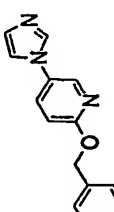
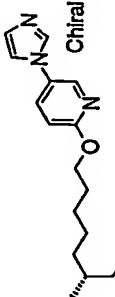
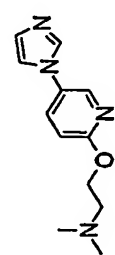
化合物 60		δ 0.91 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.57 (m, 2H), 3.47 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.52 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 306, M-H = 304.	10.0
化合物 61		δ 1.22 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 3H), 1.96 (m, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.55 (m, 1H), 4.43 (dd, $J = 7.0$, 6.4Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	
化合物 62		δ 3.82 (m, 2H), 4.10 (m, 2H), 4.53 (m, 2H), 5.20-5.35 (m, 2H), 5.96 (ddt, $J = 17.1$, 10.4, 5.6Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	
化合物 63		δ 1.26 (s, 6H), 2.01 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 3.24 (s, 3H), 4.45 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	36.3
化合物 64		δ 0.89 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.26-1.37 (m, 6H), 1.57-1.64 (m, 2H), 3.53 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 290, M-H = 288.	36.8
化合物 65		δ 1.24 (s, 9H), 3.74 (m, 2H), 4.46 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	

化合物 66		M+H = 262, M-H = 260.		
化合物 67		δ 0.91 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 6H), 1.91 (m, 1H), 3.29 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 292, M-H = 290.		
化合物 68		δ 0.94 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 1.64 (m, 2H), 3.50 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	14.0	
化合物 69		δ 1.70-1.79 (m, 2H), 1.83-1.92 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.45 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 4.36 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 248, M-H = 246.		
化合物 70		δ 0.89 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 6H), 1.87 (m, 1H), 3.23 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.72 (m, 2H), 3.89 (m, 2H), 4.52 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 306, M-H = 304.		
化合物 71		δ 3.40 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.72 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.53 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 264, M-H = 262.		

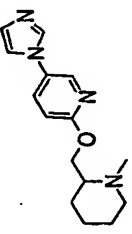
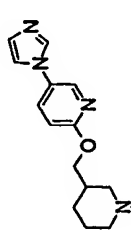
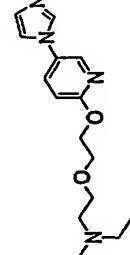
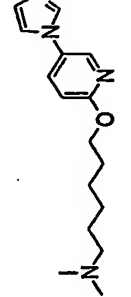
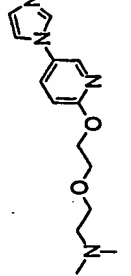
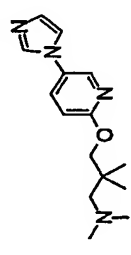
化合物 72		δ 0.93 (t, $J = 7.4\text{Hz}$, 3H), 1.40 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 3.54 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	30.1	
化合物 73		δ 1.20 (d, $J = 6.2\text{Hz}$, 6H), 3.70 (m, 1H), 3.80 (m, 2H), 4.49 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 248, M-H = 246.		
化合物 74		δ 0.88 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 3H), 1.27-1.31 (m, 8H), 1.57-1.61 (m, 2H), 3.53 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 304, M-H = 302.		
化合物 75		δ 0.90 (m, 3H), 1.26-1.36 (m, 4H), 1.58-1.62 (m, 2H), 3.53 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 276, M-H = 274.	41.3	
化合物 76		δ 0.89 (m, 3H), 1.26-1.33 (m, 4H), 1.54-1.61 (m, 2H), 3.46 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.52 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 320, M-H = 318.	53.5	
化合物 77		M+H = 246, M-H = 244.	39.6	

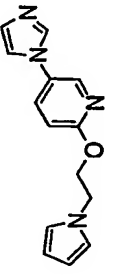
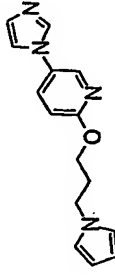
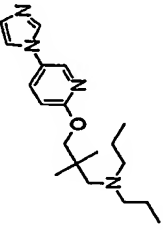
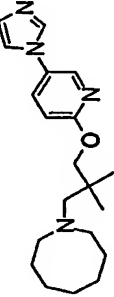
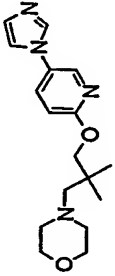
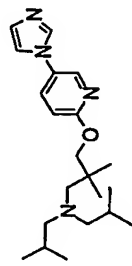
化合物 78		M+H = 234, M-H = 232.	18.4	
化合物 79		M+H = 248, M-H = 246. mp 110.0-115.0 °C	28.4	
化合物 80		M+H = 246, M-H = 244.	56.8	
化合物 81		M+H = 246, M-H = 244.	49.1	
化合物 82		M+H = 246, M-H = 244.		
化合物 83		M+H = 248, M-H = 246.		

化合物 84		δ 1.43–1.68 (m, 5H), 1.91 (m, 1H), 3.51 (m, 1H), 3.74 (m, 1H), 4.06 (m, 1H), 4.30 (dd, $J = 11.3, 6.7\text{Hz}$, 1H), 4.37 (dd, $J = 11.3, 3.5\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	28.9
化合物 85		δ 1.41 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 3.87 (dd, $J = 8.4, 6.1\text{Hz}$, 1H), 4.17 (dd, $J = 8.4, 6.4\text{Hz}$, 1H), 4.35–4.54 (m, 3H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 276, M-H = 274.	27.7
化合物 86		M+H = 232, M-H = 230.	24.7
化合物 87		δ 2.20 (s, 3H), 2.91 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.55 (t, $J = 6.8, 2\text{Hz}$), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 236, M-H = 234.	39.1
化合物 88		δ 1.31 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.66 (q, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 2.93 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 4.53 (d, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 250, M-H = 248.	57.1
化合物 89		δ 2.10 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.68 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 4.44 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 250, M-H = 248.	58.8

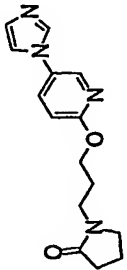
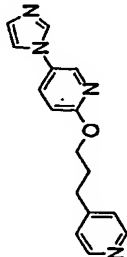
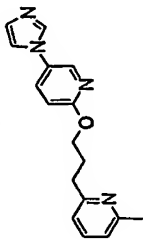
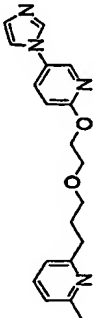
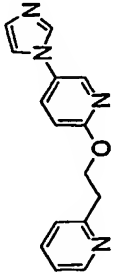
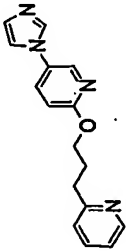
化合物 90		M+H = 244, M-H = 242.	49.0	
化合物 91		δ 2.07 (m, 2H), 2.30 (m, 2H), 4.41 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	60.2	
化合物 92		δ 0.97&1.05 (d, J = 5.9&7.0Hz, 3H), 1.77-1.87 (m, 2H), 2.00-2.29 (m, 4H), 4.18-4.44 (m, 2H), 5.66 (d, J = 5.8Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 270, M-H = 268.	102.8	
化合物 93		δ 5.42 (s, 2H), 6.92 (dd, J = 8.8, 0.6Hz, 1H), 7.21 (d, J = 10.7Hz, 1H), 7.31-7.43 (m, 3H), 7.46-7.49 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.8, 2.8Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 8.25 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 252, M-H = 250.		
化合物 94		δ 0.86 (m, 6H), 1.13 (m, 2H), 1.26-1.47 (m, 7H), 1.84 (m, 2H), 4.33 (t, J = 6.8Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 288, M-H = 286.		
化合物 95		δ 2.35 (s, 6H), 2.74 (t, J = 5.6Hz, 2H), 4.45 (t, J = 5.6Hz, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 233, M-H = 231.	59.1	

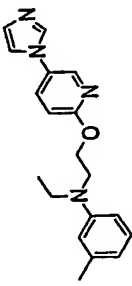
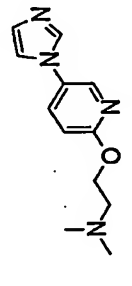
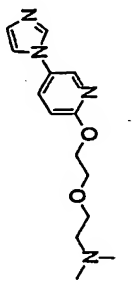
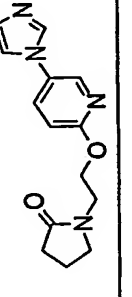
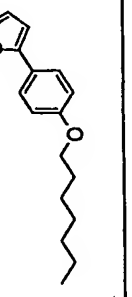
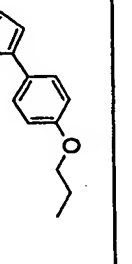
化合物 96		δ 1.09 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.67 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.90 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 4.44 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 261, M-H = 259.	46.1
化合物 97		δ 1.63-2.02 (m, 6H), 2.21 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 3.11 (m, 1H), 4.39 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 273, M-H = 271.	21.9
化合物 98		δ 2.59 (m, 4H), 2.82 (t, $J = 5.8\text{Hz}$, 2H), 3.75 (m, 4H), 4.50 (t, $J = 5.8\text{Hz}$, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9$, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9$, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H). M+H = 275, M-H = 273.	47.9
化合物 99		δ 5.55 (s, 2H), 7.00 (dd, $J = 8.7$, 0.6Hz, 1H), 7.19-7.25 (m, 3H), 7.46 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.65 (dd, $J = 8.7$, 2.8Hz, 1H), 7.70 (dd, $J = 7.8$, 1.9Hz, 1H), 7.74 (m, 1H), 8.23 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H), 8.63 (ddd, $J = 4.8$, 1.9, 0.9Hz, 1H). M+H = 253, M-H = 251. mp 128.0-131.0 °C.	61.9
化合物 100		δ 5.45 (s, 2H), 6.93 (dd, $J = 8.6$, 0.6Hz, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.32 (dd, $J = 8.9$, 5.0Hz, 1H), 7.64 (dd, $J = 8.6$, 2.8Hz, 1H), 7.75 (d, $J = 1.0\text{Hz}$, 1H), 7.80 (m, 1H), 8.25 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H), 8.59 (dd, $J = 5.0$, 1.7Hz, 1H), 8.74 (d, $J = 1.7\text{Hz}$, 1H). M+H = 253, M-H = 251. mp 105.0-107.0 °C.	92.6
化合物 101		δ 5.46 (s, 2H), 6.99 (dd, $J = 8.8$, 0.6Hz, 1H), 7.19-7.24 (m, 2H), 7.36 (m, 2H), 7.66 (dd, $J = 8.8$, 2.8Hz, 1H), 7.76 (t, $J = 1.1\text{Hz}$, 1H), 8.22 (dd, $J = 2.8$, 0.6Hz, 1H), 8.62 (dd, $J = 4.5$, 1.7Hz, 2H). M+H = 253, M-H = 251. mp 86.0-91.0 °C.	90.0

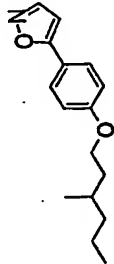
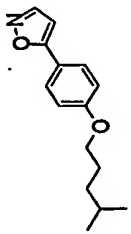
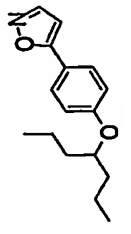
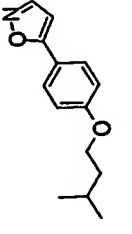
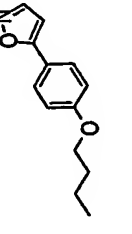
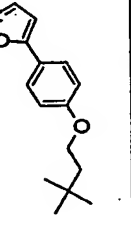
化合物 102		δ 1.26-1.83 (m, 6H), 2.16 (m, 1H), 2.97 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.93 (m, 1H), 4.39 (dd, $J = 11.2, 3.9\text{Hz}$, 1H), 4.43 (dd, $J = 11.2, 4.2\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 273, M-H = 271.	52.6	
化合物 103		δ 0.81-1.15 (m, 2H), 1.59-1.86 (m, 3H), 1.95 (m, 1H), 2.21 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.80 (m, 1H), 2.99 (m, 1H), 4.14 (dd, $J = 10.5, 7.5\text{Hz}$, 1H), 4.26 (dd, $J = 10.5, 5.6\text{Hz}$, 1H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 273, M-H = 271.	30.2	
化合物 104		δ 1.04 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.59 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.70 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 3.64 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 3.84 (m, 2H), 4.51 (m, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 305, M-H = 303.	19.0	
化合物 105		M+H = 181, M-H = 179.	60.4	
化合物 106		M+H = 277, M-H = 275.	50.3	
化合物 107		δ 1.01 (s, 6H), 2.30 (s, 8H), 4.10 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 277, M-H = 273 mp 68.5-69.0 °C.	34.1	>1,000

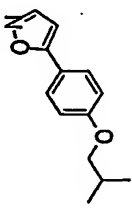
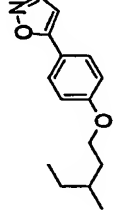
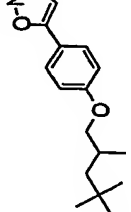
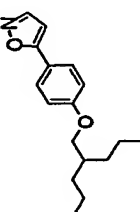
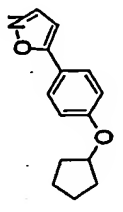
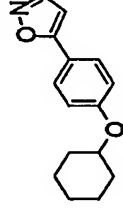
化合物 108		δ 4.30 (t, J = 5.5Hz, 2H), 4.62 (t, J = 5.5Hz, 2H), 6.17 (t, J = 2.1Hz, 2H), 6.75 (t, J = 2.1Hz, 2H), 6.83 (dd, J = 8.7, 0.6Hz, 1H), 7.19 (t, J = 1.2Hz, 1H), 7.23 (t, J = 1.2Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.7, 2.8Hz, 1H), 7.75 (t, J = 1.2Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 255, M-H = 253.	66.8	
化合物 109		δ 2.25 (tt, J = 6.8, 6.1Hz, 2H), 4.10 (t, J = 6.8Hz, 2H), 4.32 (t, J = 6.1Hz, 2H), 6.15 (dd, J = 4.2, 2.2Hz, 2H), 6.87 (dd, J = 8.8, 0.6Hz, 1H), 7.20 (m, 2H), 7.60 (dd, J = 8.8, 2.8Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 1.2, 0.9Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 269, M-H = 267.	73.8	
化合物 110		M+H = 331, M-H = 329. mp 115.0-121.0 °C	47.3	
化合物 111		M+H = 343, M-H = 341.	76.0	
化合物 112		δ 0.99 (s, 6H), 2.31 (s, 2H), 2.49-2.56 (m, 4H), 3.60-3.71 (m, 4H), 4.10 (s, 2H), 6.85 (dd, J = 0.6, 8.7Hz, 1H), 7.18 (t, J = 1.2Hz, 1H), 7.22 (t, J = 1.1Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 2.8, 8.7Hz, 1H), 7.74 (t, J = 1.2Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 0.6, 2.8Hz, 1H)	44.5	
化合物 113		δ 0.84 (d, J = 6.7Hz, 12H), 1.00 (s, 6H), 1.66-1.70 (m, 2H), 2.11 (d, J = 7.0Hz, 4H), 2.34 (s, 2H), 4.09 (s, 2H), 6.85 (dd, J = 8.9, 0.6Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.9, 2.8Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 2.8, 0.6Hz, 1H). M+H = 360, M-H = 358.	33.9	

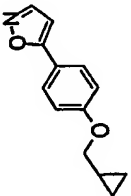
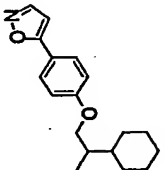
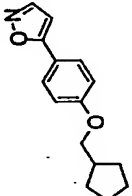
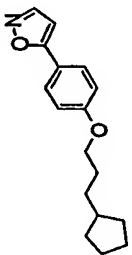
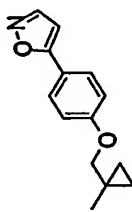
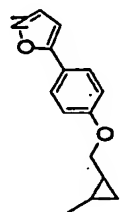
化合物 114		δ 0.98 (s, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.40 (m, 4H), 2.58 (m, 4H), 4.08 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 330, M-H = 328.	37.5	
化合物 115		δ 0.93 & 0.99 (s, 6H), 1.09 & 1.44 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 6H), 2.10 (m, 2H), 2.27 (s, 2H), 2.60 (d, $J = 10.1\text{Hz}$, 2H), 3.60-3.66 (m, 2H), 4.10 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 345, M-H = 343.	45.6	
化合物 116		M+H = 315, M-H = 313.	15.9	
化合物 117		δ 1.03 (s, 6H), 1.68-1.74 (m, 4H), 2.48 (s, 2H), 2.60 (m, 4H), 4.11 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 301, M-H = 299.	32.7	
化合物 118		δ 0.96 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 0.98 (s, 6H), 2.36 (s, 2H), 2.49 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 4.07 (s, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6\text{Hz}$, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8\text{Hz}$, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6\text{Hz}$, 1H). M+H = 303, M-H = 301.	41.7	
化合物 119		M+H = 273, M-H = 271.	3.0	

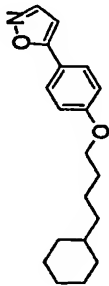
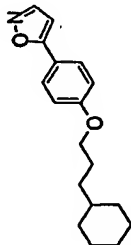
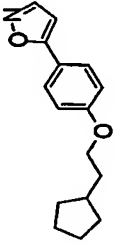
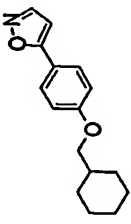
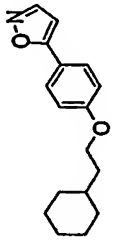
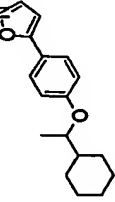
化合物 120		δ 1.68 (m, 2H), 2.07 (m, 2H), 2.41 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 4.37 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 6.85 (dd, $J = 8.9, 0.6$ Hz, 1H), 7.19 (m, 2H), 7.58 (dd, $J = 8.9, 2.8$ Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 8.21 (dd, $J = 2.8, 0.6$ Hz, 1H). M+H = 287, M-H = 285.	28.5	
化合物 121		M+H = 281, M-H = 279.	65.0	
化合物 122		M+H = 295, M-H = 293.	55.7	
化合物 123		M+H = 339, M-H = 337.	46.7	
化合物 124		M+H = 267, M-H = 265.	58.1	
化合物 125		M+H = 281, M-H = 279.	53.9	

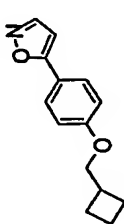
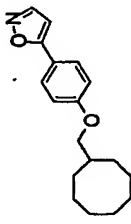
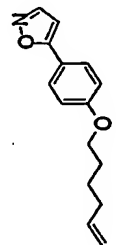
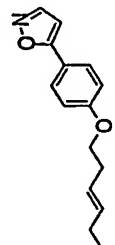
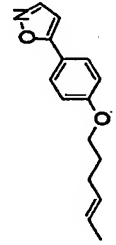
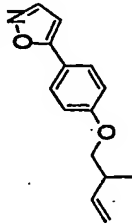
化合物 126		M+H = 323, M-H = 321.	86.9	
化合物 127		M+H = 233, M-H = 231.	1.4	
化合物 128		M+H = 277, M-H = 275.	56.4	
化合物 129		M+H = 273, M-H = 271.	22.3	
化合物 130		(200 MHz) δ 0.90 (t, J = 6.6Hz, 3H), 1.23-1.58 (m, 8H), 1.81 (quint, J = 6.6Hz, 2H), 4.01 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258. mp 42.0-44.0 °C.	36.6	
化合物 131		(200 MHz) δ 1.06 (t, J = 7.0Hz, 3H), 1.84 (dt, J = 7.0Hz, 2H), 3.98 (t, J = 7.0Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 204, M-H = 202. mp 51.0-53.0 °C.	17.3	

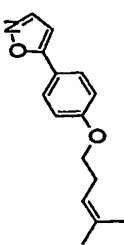
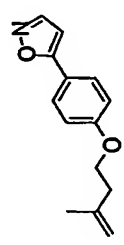
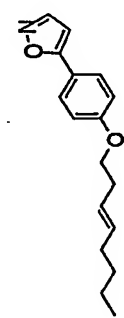
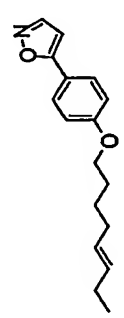
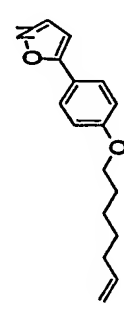
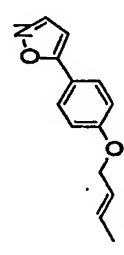
化合物 132		(200 MHz) δ 0.91 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.4$ Hz, 3H), 1.10–1.43 (m, 4H), 1.56–1.91 (m, 3H), 4.05 (dt, $J = 1.1, 6.6$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	45.8	26.5
化合物 133		(200 MHz) δ 0.93 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 1.30–1.41 (m, 2H), 1.64 (ddt, $J = 6.6$ Hz, 1H), 1.78–1.89 (m, 2H), 4.00 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	62.1	25.0
化合物 134		(200 MHz) δ 0.94 (t, $J = 7.0$ Hz, 6H), 1.26–1.72 (m, 8H), 433 (quint, $J = 5.7$ Hz, 1H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	15.8	
化合物 135		(200 MHz) δ 0.98 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 1.70 (q, $J = 6.6$ Hz, 2H), 1.84 (ddt, $J = 6.6$ Hz, 1H), 4.05 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 232, M-H = 230.	44.0	
化合物 136		(200 MHz) δ 0.99 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.46–1.56 (m, 2H), 1.73–1.87 (m, 2H), 4.02 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 218, M-H = 216. mp 44.0–46.0 °C.	45.5	
化合物 137		(200 MHz) δ 1.00 (s, 9H), 1.75 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 4.08 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244. mp 53.0–50.0 °C.	35.3	26.0

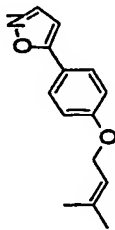
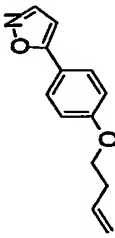
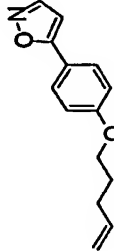
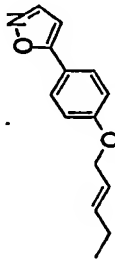
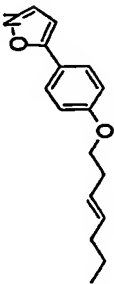
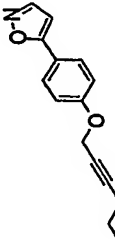
化合物 138		(200 MHz) δ 1.04 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 2.11 (ddt, J = 6.6 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 218, M-H = 216. mp 48.0–50.0 °C.	38.3	
化合物 139		(200 MHz) δ 0.92 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 1.17–1.52 (m, 2H), 1.54–1.70 (m, 2H), 1.80–1.91 (m, 1H), 4.05 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.		
化合物 140		(200 MHz) δ 0.95 (s, 9H), 1.09 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.43–1.48 (m, 2H), 1.98–2.27 (m, 1H), 3.70 (dd, J = 7.4, 9.0 Hz, 1H), 3.83 (dd, J = 5.9, 9.0 Hz, 1H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 274, M-H = 272.	47.4	
化合物 141		(200 MHz) δ 0.84–0.99 (m, 6H), 1.32–1.50 (m, 8H), 1.75–1.92 (m, 1H), 3.89 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 274, M-H = 272.	21.4	
化合物 142		(200 MHz) δ 1.60–2.00 (m, 8H), 4.86–4.78 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228. mp 98.0–100.0 °C.	37.3	
化合物 143		(200 MHz) δ 1.24–1.64 (m, 6H), 1.72–1.90 (m, 2H), 1.92–2.10 (m, 2H), 4.26–4.38 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242. mp 66.0–68.0 °C.	38.5	

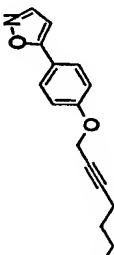
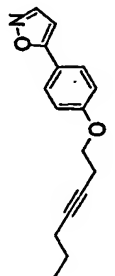
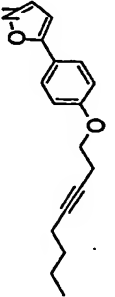
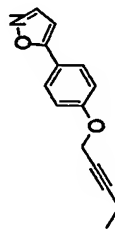
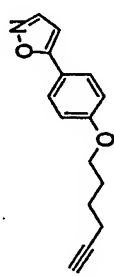
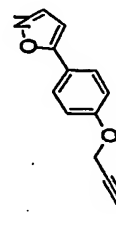
化合物 144		(200 MHz) δ 0.34–0.41 (m, 2H), 0.63–0.72 (m, 2H), 1.22–1.48 (m, 1H), 3.87 (d, $J = 7.0$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 216, M-H = 214.	33.9	
化合物 145		(200 MHz) δ 0.99 (d, $J = 7.0$ Hz, 3H), 1.05–1.50 (m, 6H), 1.60–1.92 (m, 6H), 3.81 (dd, $J = 7.0$, 9.2Hz, 1H), 3.98 (dd, $J = 5.7$, 9.2Hz, 1H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 286, M-H = 284.	29.3	
化合物 146		(200 MHz) δ 1.30–1.48 (m, 2H), 1.57–1.72 (m, 4H), 1.75–1.95 (m, 2H), 2.39 (sept, $J = 7.0$ Hz, 1H), 3.89 (d, $J = 6.8$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242. mp 69.0–72.0 °C	56.7	13.1
化合物 147		(200 MHz) δ 1.02–1.20 (m, 2H), 1.41–1.66 (m, 6H), 1.72–1.90 (m, 5H), 4.00 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270. mp 52.0–53.0 °C	40.2	
化合物 148		(200 MHz) δ 0.46 (m, 2H), 0.56 (m, 2H), 1.25 (s, 3H), 3.79 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	64.0	95.6
化合物 149		(200 MHz) δ 0.40 (dt, $J = 5.0$, 8.1Hz, 1H), 0.52 (dt, $J = 4.8$, 8.1Hz, 1H), 0.72–0.94 (m, 1H), 1.01–1.07 (m, 1H), 1.11 (d, $J = 5.9$ Hz, 3H), 3.82–3.90 (m, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	41.1	

化合物 150		(200 MHz) δ 0.78–0.99 (m, 2H), 1.15–1.53 (m, 6H), 1.40–1.86 (m, 9H), 4.00 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 300, M-H = 298.	12.1	
化合物 151		(200 MHz) δ 0.80–1.05 (m, 2H), 1.17–1.41 (m, 6H), 1.61–1.89 (m, 7H), 3.99 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 286, M-H = 284.		
化合物 152		(200 MHz) δ 1.10–1.29 (m, 2H), 1.46–1.74 (m, 4H), 1.79–1.93 (m, 4H), 1.98 (sept, J = 6.8Hz, 1H), 4.04 (t, J = 6.8Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	50.4	
化合物 153		(200 MHz) δ 0.98–1.42 (m, 5H), 1.64–1.95 (m, 6H), 3.81 (d, J = 6.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256. mp 88.0–90.0 °C	49.0	
化合物 154		(200 MHz) δ 0.78–1.39 (m, 6H), 1.45–1.85 (m, 7H), 4.05 (t, J = 6.8Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270. mp 53.0–56.0 °C.	36.4	97.8
化合物 155		(200 MHz) δ 1.00–1.35 (m, 5H), 1.28 (d, J = 6.2Hz, 3H), 1.56–1.98 (m, 6H), 4.25 (quint, J = 6.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	36.2	

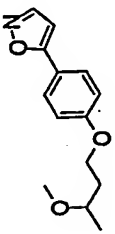
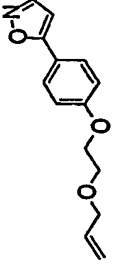
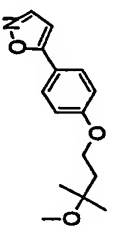
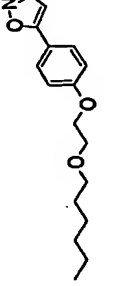
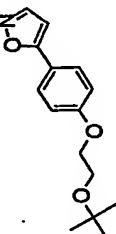
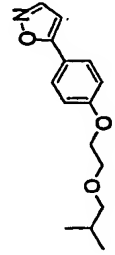
化合物 156		(200 MHz) δ 1.83-2.22 (m, 6H), 2.72-2.87 (m, 1H), 3.98 (d, J = 6.6Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228. mp 52.0-54.0 °C.	51.3	
化合物 157		(200 MHz) δ 1.31-1.88 (m, 14H), 1.96-2.15 (m, 1H), 3.78 (d, J = 6.8Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 286, M-H = 284.	36.7	42.9
化合物 158		(200 MHz) δ 1.51-1.64 (m, 2H), 1.77-1.95 (m, 2H), 2.14 (q, J = 7.0Hz, 2H), 4.02 (t, J = 6.4Hz, 2H), 4.96-5.10 (m, 2H), 5.74-5.94 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	56.6	28.1
化合物 159		(200 MHz) δ 0.99 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.05 (q, J = 7.5Hz, 2H), 2.51 (q, J = 7.0Hz, 2H), 4.01 (t, J = 7.0Hz, 2H), 5.41-5.71 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	51.3	15.0
化合物 160		(200 MHz) δ 1.66 (dd, J = 1.6, 3.6Hz, 3H), 1.86 (quint, J = 6.4Hz, 2H), 2.13-2.23 (m, 2H), 4.01 (t, J = 6.4Hz, 2H), 5.45-5.57 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	48.6	
化合物 161		(200 MHz) δ 1.17 (d, J = 6.8Hz, 3H), 2.70 (sept, J = 6.8Hz, 1H), 3.84 (dd, J = 6.8, 9.0Hz, 1H), 3.95 (dd, J = 6.4, 9.0Hz, 1H), 5.07-5.21 (m, 2H), 5.88 (ddd, J = 6.8, 10.3, 17.1Hz, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	46.3	

化合物 162		(200 MHz) δ 1.68 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.51 (q, J = 7.0Hz, 2H), 3.99 (t, J = 7.0Hz, 2H), 5.18–5.26 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 244, M-H = 242.	59.0	
化合物 163		(200 MHz) δ 1.82 (s, 3H), 2.53 (t, J = 6.6Hz, 2H), 4.29 (t, J = 6.6Hz, 2H), 4.82 (brs, 1H), 4.87 (brs, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.		
化合物 164		(200 MHz) δ 0.91 (t, J = 6.8Hz, 3H), 1.25–1.41 (m, 4H), 2.10 (brq, J = 6.8Hz, 2H), 2.57 (q, J = 6.8Hz, 2H), 4.01 (t, J = 6.8Hz, 2H), 5.39–5.63 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	35.6	
化合物 165		(200 MHz) δ 0.97 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.51–1.62 (m, 2H), 1.76–1.90 (m, 2H), 2.00–2.17 (m, 4H), 4.02 (t, J = 6.4Hz, 2H), 5.29 (dd, J = 6.2, 10.9Hz, 1H), 5.44 (dd, J = 5.7, 10.9Hz, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	51.3	20.4
化合物 166		(200 MHz) δ 1.41–1.52 (m, 4H), 1.75–1.90 (m, 2H), 2.05–2.15 (m, 2H), 4.01 (t, J = 6.6Hz, 2H), 4.93–5.08 (m, 2H), 5.73–5.93 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	48.2	17.5
化合物 167		(200 MHz) δ 1.78 (dd, J = 1.3, 6.1Hz, 3H), 4.52 (dd, J = 1.1, 5.1Hz, 2H), 5.67–5.96 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 216. mp 47.0–50.0 °C	51.9	

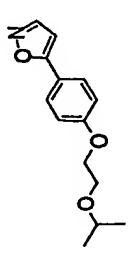
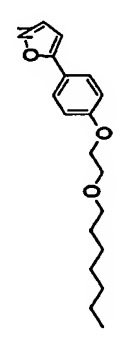
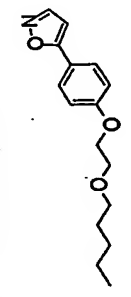
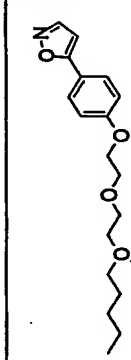
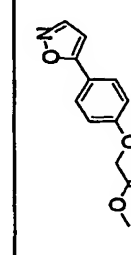
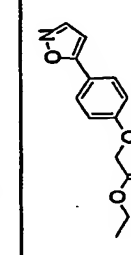
化合物 168		M+H = 230, M-H = 228.	36.8	
化合物 169		(200 MHz) δ 2.58 (q, J = 6.8Hz, 2H), 4.08 (t, J = 6.8Hz, 2H), 5.11-5.25 (m, 2H), 5.82-6.02 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 216, M-H = 214.	67.1	
化合物 170		(200 MHz) δ 1.91 (q, J = 6.8Hz, 2H), 2.21-2.32 (m, 2H), 4.03 (t, J = 6.6Hz, 2H), 4.99-5.13 (m, 2H), 5.77-5.97 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228. mp 43.0-45.5 °C	71.8	6.9
化合物 171		(200 MHz) δ 1.04 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.11-2.25 (m, 2H), 4.64 (d, J = 5.2Hz, 2H), 5.64 (dd, J = 5.2, 11.0Hz, 1H), 5.72 (dd, J = 6.2, 11.0Hz, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 230, M-H = 228.	50.0	
化合物 172		(200 MHz) δ 0.93 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.36-1.51 (m, 2H), 2.08 (q, J = 6.8Hz, 2H), 2.57 (q, J = 6.8Hz, 2H), 4.02 (t, J = 6.8Hz, 2H), 5.41-5.63 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	52.4	
化合物 173		(200 MHz) δ 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.53 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.21 (tt, J = 2.1, 6.8Hz, 2H), 4.74 (t, J = 2.1Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240.	33.8	

化合物 174		(200 MHz) δ 0.89 (t, J = 7.0Hz, 3H), 1.26-1.58 (m, 4H), 2.19-2.27 (m, 2H), 4.72 (t, J = 2.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 256, M-H = 254.		
化合物 175		(200 MHz) δ 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.52 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.15 (tt, J = 2.4, 7.2Hz, 2H), 2.68 (tt, J = 2.4, 7.2Hz, 2H), 4.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 256, M-H = 254.		
化合物 176		(200 MHz) δ 0.91 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.36-1.60 (m, 4H), 2.10-2.24 (m, 2H), 2.61-2.75 (m, 2H), 4.11 (t, J = 7.3Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 270, M-H = 268.	42.3	
化合物 177		(200 MHz) δ 1.14 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.24 (ddt, J = 2.1, 7.5, 13.0Hz, 2H), 4.73 (t, J = 2.1Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 228, M-H = 226.	41.1	
化合物 178		(200 MHz) δ 1.70-1.81 (m, 2H), 1.90-1.99 (m, 3H), 2.30 (dt, J = 2.6, 7.0Hz, 2H), 4.05 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240. mp 48.0-50.5 °C.	98.0	4.8
化合物 179		(200 MHz) δ 1.88 (t, J = 2.4Hz, 3H), 4.71 (q, J = 2.4Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 214, M-H = 212.	44.6	

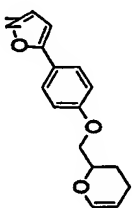
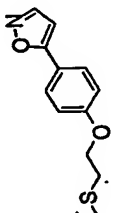
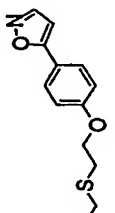
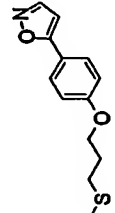
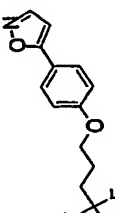
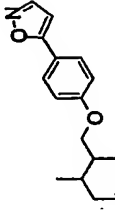
化合物 180		(200 MHz) δ 1.99 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 2.05 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 2.43 (dt, J = 2.4, 6.8 Hz, 2H), 4.14 (t, J = 6.2 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 228, M-H = 226. mp 86.0–87.0 °C.	74.7	
化合物 181		(200 MHz) δ 1.13 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 2.19 (ddt, J = 2.4, 7.5, 14.9 Hz, 2H), 2.67 (tt, J = 2.4, 7.3 Hz, 2H), 4.11 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 242, M-H = 240.	61.4	
化合物 182		(200 MHz) δ 1.22 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 3.54 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.60–3.65 (m, 2H), 3.72–3.76 (m, 2H), 3.87–3.92 (m, 2H), 4.18–4.23 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 278, M-H = 276.	31.4	
化合物 183		(200 MHz) δ 3.47 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 4.17 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 220, M-H = 218.	44.5	
化合物 184		(200 MHz) δ 1.26 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 3.62 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.82 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 234, M-H = 232.	50.4	
化合物 185		(200 MHz) δ 0.91 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.32–1.43 (m, 2H), 1.51–1.61 (m, 2H), 3.48 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 3.60–3.64 (m, 2H), 3.71–3.76 (m, 2H), 3.89 (m, 2H), 4.19 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 306, M-H = 304.	66.1	

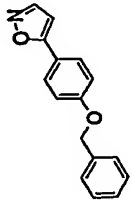
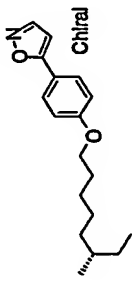
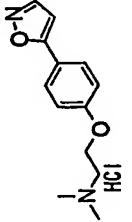
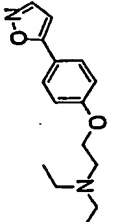
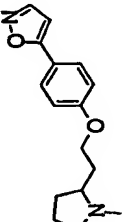
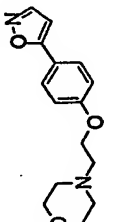
化合物 186		(200 MHz) δ 1.22 (d, $J = 6.2$ Hz, 3H), 1.96 (q, $J = 6.2$ Hz, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.58 (sext, $J = 6.2$ Hz, 1H), 4.05-4.21 (m, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	13.7
化合物 187		(200 MHz) δ 3.83 (m, 2H), 4.11 (dt, $J = 1.3, 4.6$ Hz, 2H), 4.19 (m, 2H), 5.20-5.38 (m, 2H), 5.86-6.05 (m, 1H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	92.5
化合物 188		(200 MHz) δ 1.26 (s, 6H), 2.03 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.23 (s, 3H), 4.13 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	30.7
化合物 189		(200 MHz) δ 0.89 (t, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.23-1.41 (m, 4H), 1.52-1.75 (m, 4H), 3.54 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.81 (dd, $J = 4.6, 5.0$ Hz, 2H), 4.18 (dd, $J = 4.6, 5.0$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 290, M-H = 288.	38.8
化合物 190		(200 MHz) δ 1.24 (s, 9H), 3.74 (m, 2H), 4.14 (m, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	37.2
化合物 191		(200 MHz) δ 0.92 (d, $J = 6.8$ Hz, 6H), 1.91 (ddt, $J = 6.8$ Hz, 1H), 3.31 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.81 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	36.7

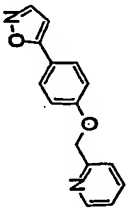
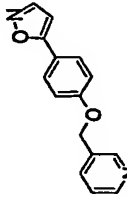
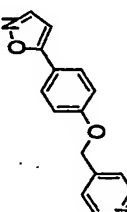
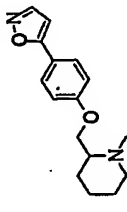
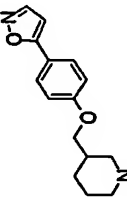
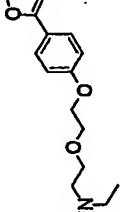
化合物 192			22.7	
化合物 193		M+H = 292, M-H = 290. (200 MHz) δ 0.92 (t, J = 6.8Hz, 3H), 1.64 (q, J = 6.8Hz, 2H), 3.51 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.82 (m, 2H), 4.19 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	46.3	
化合物 194		(200 MHz) δ 1.69-1.97 (m, 4H), 3.36 (s, 3H), 3.46 (t, J = 6.2Hz, 2H), 4.05 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	72.7	32.7
化合物 195		(200 MHz) δ 0.90 (d, J = 6.6Hz, 6H), 1.91 (ddt, J = 6.6Hz, 1H), 3.24 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.59-3.64 (m, 2H), 3.71-3.76 (m, 2H), 3.90 (m, 2H), 4.19 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 306, M-H = 304.	58.9	
化合物 196		(200 MHz) δ 3.40 (s, 3H), 3.57-3.61 (m, 2H), 3.71-3.76 (m, 2H), 3.89 (m, 2H), 4.21 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 264, M-H = 262.	14.6	
化合物 197		(200 MHz) δ 0.93 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.38-1.48 (m, 2H), 1.54-1.65 (m, 2H), 3.55 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.78-3.83 (m, 2H), 4.15-4.20 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 262, M-H = 260.	19.0	

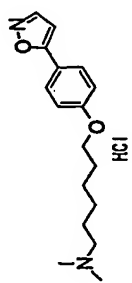
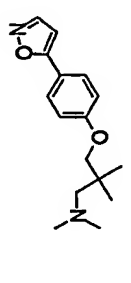
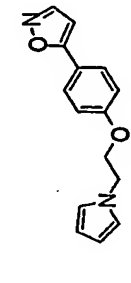
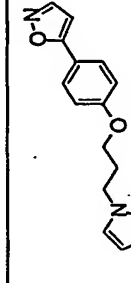
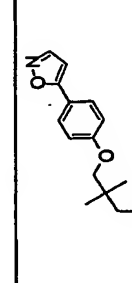
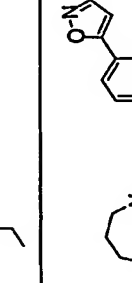
化合物 198		(200 MHz) δ 1.21 (d, J = 6.2 Hz, 6H), 3.70 (sept, J = 6.2 Hz, 1H), 3.80 (t, J = 5.0 Hz, 2H), 4.17 (t, J = 5.0 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.		
化合物 199		(200 MHz) δ 0.88 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 1.22-1.40 (m, 8H), 1.52-1.70 (m, 2H), 3.54 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 3.78-3.83 (m, 2H), 4.15-4.20 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 304, M-H = 302.		
化合物 200		(200 MHz) δ 0.90 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 1.23-1.40 (m, 4H), 1.55-1.66 (m, 2H), 3.54 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 3.79-3.83 (m, 2H), 4.15-4.20 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 276, M-H = 274.	32.1	
化合物 201		(200 MHz) δ 0.89 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24-1.39 (m, 4H), 1.52-1.67 (m, 2H), 3.47 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 3.59-3.64 (m, 2H), 3.71-3.76 (m, 2H), 3.89 (m, 2H), 4.21 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 320, M-H = 318.	37.7	
化合物 202		(200 MHz) δ 3.83 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 234, M-H = 232.	21.0	
化合物 203		(200 MHz) δ 1.31 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 4.30 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 4.68 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H). M+H = 248, M-H = 246.	38.9	

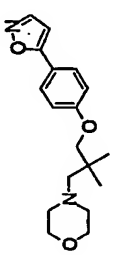
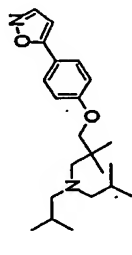
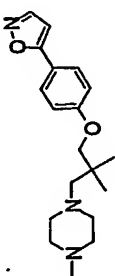
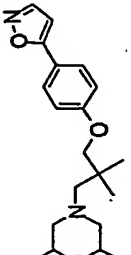
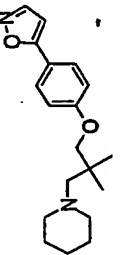
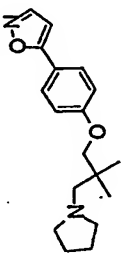
化合物 204		(200 MHz) δ 1.67-1.74 (m, 1H), 2.06-2.22 (m, 1H), 2.73-2.82 (m, 1H), 3.70-4.04 (m, 6H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244. mp 58.0-61.0 °C	62.4	12.9
化合物 205		(200 MHz) δ 1.74-2.19 (m, 4H), 3.80-4.00 (m, 2H), 4.02 (d, J = 5.1Hz, 2H), 4.24-4.39 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.	24.2	
化合物 206		(200 MHz) δ 1.14 (s, 3H), 3.64-3.94 (m, 2H), 3.98 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 246, M-H = 244.		
化合物 207				
化合物 208		M+H = 248, M-H = 246. (200 MHz) δ 1.40-1.77 (m, 6H), 3.47-3.60 (m, 1H), 3.65-3.80 (m, 1H), 3.93 (dd, J = 4.1, 10.1Hz, 1H), 4.04 (dd, J = 4.6, 10.1Hz, 1H), 4.02-4.12 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 260, M-H = 258.	63.6	
化合物 209		(200 MHz) δ 1.99-2.12 (m, 2H), 3.73-3.83 (m, 2H), 3.96 (dd, J = 7.3, 9.5Hz, 1H), 4.08 (dd, J = 3.3, 9.5Hz, 1H), 4.24-4.37 (m, 1H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 232, M-H = 230.	65.1	25.4

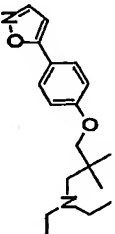
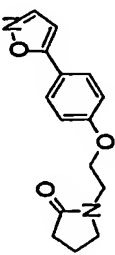
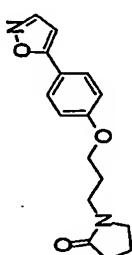
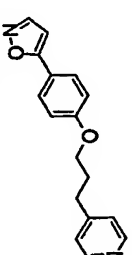
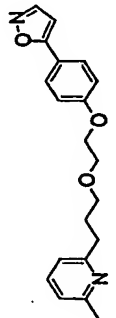
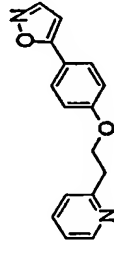
化合物 210		(200 MHz) δ 1.80-2.18 (m, 4H), 3.87-4.25 (m, 3H), 4.75 (m, 1H), 6.40 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.43 (dd, J = 1.7, 6.2Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.25 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 258, M-H = 256.	79.2	33.8
化合物 211		(200 MHz) δ 2.24 (s, 3H), 2.92 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 4.22 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 236, M-H = 234.	53.1	
化合物 212		(200 MHz) δ 1.31 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.67 (q, J = 7.5Hz, 2H), 2.94 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 4.20 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 250, M-H = 248.	56.2	
化合物 213		(200 MHz) δ 2.08 (quint, J = 6.2Hz, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.71 (brt, J = 6.2 Hz, 2H), 4.13 (t, J = 6.2 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 250, M-H = 248. mp 54.0-58.0 °C.	64.3	31.9
化合物 214		(200 MHz) δ 2.02-2.15 (m, 2H), 2.20-2.47 (m, 2H), 4.08 (t, J = 5.9Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 272, M-H = 270.	90.4	
化合物 215		(200 MHz) δ 1.04 (d, J = 5.7Hz, 3H), 2.04-2.38 (m, 6H), 3.95 (dd, J = 5.9, 9.3Hz, 1H), 4.05 (dd, J = 4.0, 9.3Hz, 1H), 5.60-5.75 (m, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 270, M-H = 268.	75.1	46.2

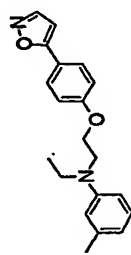
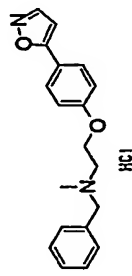
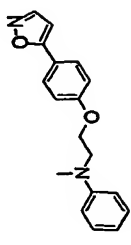
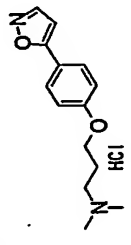
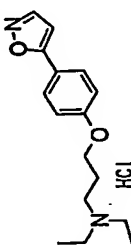
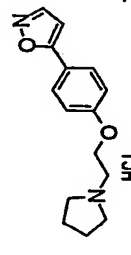
化合物 216		(200 MHz) δ 5.13 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.30–7.50 (m, 5H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 252, M-H = 250. mp 93.0–95.0 °C.	30.6
化合物 217		(200 MHz) δ 0.83–0.90 (m, 6H), 1.08–1.54 (m, 9H), 1.75–1.88 (m, 2H), 3.99 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 288, M-H = 286.	
化合物 218		mp 203.0–205.0 °C (dec.)	28.9
化合物 219		(200 MHz) δ 1.08 (t, $J = 7.2$ Hz, 6H), 2.65 (q, $J = 7.2$ Hz, 4H), 2.90 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 4.10 (t, $J = 6.3$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 261, M-H = 259.	16.9
化合物 220		M+H = 273, M-H = 271.	20.9
化合物 221		(200 MHz) δ 2.57–2.62 (m, 2H), 2.83 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 3.73–3.77 (m, 4H), 4.17 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 275, M-H = 273.	27.0

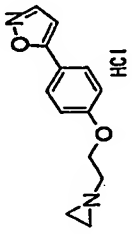
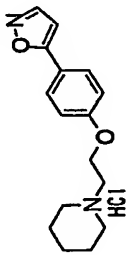
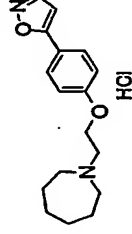
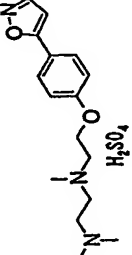
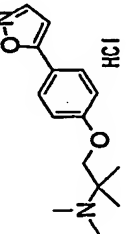
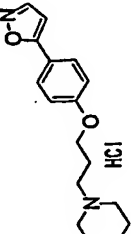
化合物 222		(200 MHz) δ 5.27 (s, 2H), 6.40 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 7.23–7.29 (m, 1H), 7.52 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.75 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 7.70–7.73 (m, 1H), 8.26 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H). M+H = 253, M-H = 251. mp 70.0–71.0 °C.	47.6	
化合物 223		(200 MHz) δ 5.15 (s, 2H), 6.40 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 7.35 (dd, $J = 4.8, 8.9$ Hz, 1H), 7.75 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 7.75–7.83 (m, 1H), 8.26 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.62 (dd, $J = 1.5, 4.8$ Hz, 1H), 8.72 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 253, M-H = 251.	91.2	16.7
化合物 224		(200 MHz) δ 5.16 (s, 2H), 6.40 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 7.75 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.59 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H), 8.65 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H). M+H = 253.	59.6	
化合物 225		M+H = 273, M-H = 271.	18.9	
化合物 226		M+H = 273, M-H = 271.	9.9	
化合物 227		M+H = 305, M-H = 303.		

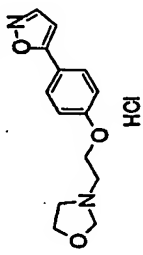
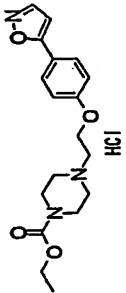
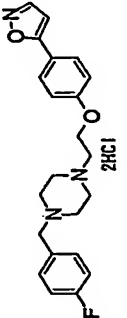
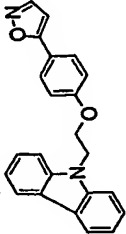
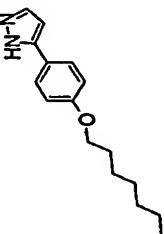
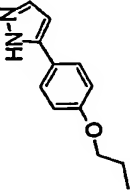
化合物 228		mp 138.0–143.5 °C	68.3	62.6
化合物 229		(200 MHz) δ 1.01 (s, 6H), 2.28 (s, 6H), 2.29 (s, 2H), 3.76 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 275, M-H = 273.	25.4	
化合物 230		(200 MHz) δ 4.12–4.35 (m, 4H), 6.19 (t, J = 2.0Hz, 2H), 6.40 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.78 (t, J = 2.0Hz, 2H), 7.08 (m, J_{AB} = 8.7Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 8.7Hz, 2H), 8.26 (d, J = 1.8Hz, 1H). M+H = 255, M-H = 253. mp 90.0–96.0 °C.	70.2	8.7
化合物 231		(200 MHz) δ 2.24 (quint, J = 6.1Hz, 2H), 3.94 (t, J = 6.1Hz, 2H), 4.13 (t, J = 6.1Hz, 2H), 6.15 (t, J = 2.0Hz, 2H), 6.40 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.66 (t, J = 2.0Hz, 2H), 7.08 (m, J_{AB} = 8.7Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 8.7Hz, 2H), 8.26 (d, J = 1.8Hz, 1H). M+H = 269, M-H = 267.	57.2	105.6
化合物 232		(200 MHz) δ 0.79 (t, J = 7.3Hz, 6H), 0.98 (s, 6H), 1.30–1.45 (m, 4H), 3.73 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 331, M-H = 329.	29.6	
化合物 233		(200 MHz) δ 0.99 (s, 6H), 1.50–1.70 (m, 10H), 2.50 (s, 2H), 2.60–2.70 (m, 4H), 3.78 (s, 2H), 6.39 (d, J = 2.0Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0Hz, 1H). M+H = 343, M-H = 341.	26.2	

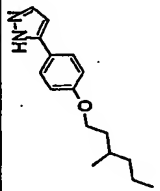
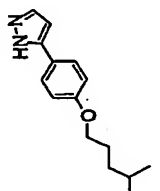
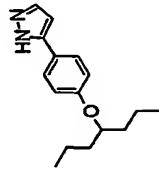
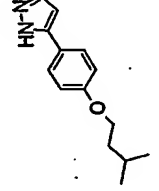
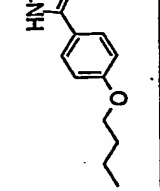
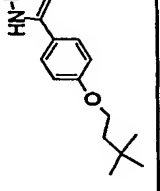
化合物 234		(200 MHz) δ 0.99 (s, 6H), 2.31 (s, 2H), 2.48-2.52 (m, 4H), 3.60-3.65 (m, 4H), 3.75 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 317, M-H = 315. mp 77.0-84.0 °C.	43.5	21.4
化合物 235		(200 MHz) δ 0.83 (d, $J = 6.6$ Hz, 12H), 0.98 (s, 6H), 1.67 (quint, $J = 6.6$ Hz, 2H), 3.56 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 360, M-H = 358.	6.3	
化合物 236		M+H = 330, M-H = 328.	27.3	
化合物 237		(200 MHz) δ 0.99 (s, 6H), 1.07 (d, $J = 6.2$ Hz, 6H), 2.28 (s, 2H), 3.74 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 345, M-H = 343.	28.6	
化合物 238		(200 MHz) δ 0.97 (s, 6H), 1.30-1.50 (m, 6H), 2.23 (s, 2H), 2.27-2.45 (m, 4H), 3.78 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 315, M-H = 313.	8.9	
化合物 239		(200 MHz) δ 1.02 (s, 6H), 2.64-2.82 (m, 4H), 2.49 (s, 2H), 2.52-2.68 (m, 4H), 3.77 (s, 2H), 6.39 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H). M+H = 301, M-H = 299.	1.1	

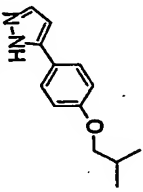
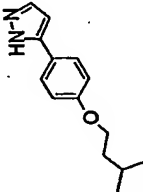
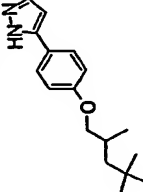
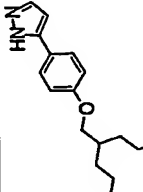
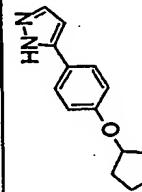
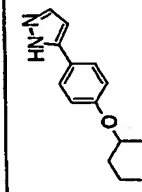
化合物 240		M+H = 303, M-H = 301. (200 MHz) δ 1.97-2.11 (m, 2H), 2.40 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 3.59 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 3.71 (t, J = 5.3 Hz, 2H), 4.18 (t, J = 5.3 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H).	13.4	
化合物 241		M+H = 273, M-H = 271. (200 MHz) δ 2.00-2.13 (m, 4H), 2.40 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 3.44 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 3.49 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 4.05 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H).	33.2	
化合物 242		M+H = 287, M-H = 285. (200 MHz) δ 2.13-2.22 (m, 2H), 2.85 (dd, J = 7.0, 8.1 Hz, 2H), 4.03 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.7 Hz, 2H), 7.16 (dd, J = 1.5, 4.1 Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.7 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.52 (dd, J = 1.5, 4.1 Hz, 2H).	43.1	
化合物 243		M+H = 281, M-H = 279. (200 MHz) δ 2.00-2.11 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.84 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.59 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.79-3.84 (m, 2H), 4.15-4.20 (m, 2H), 6.39 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.94-7.04 (m, 4H), 7.46 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.7 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 1.8 Hz, 1H).	67.4	
化合物 244		M+H = 339, M-H = 337. (200 MHz) δ 3.30 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 4.44 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 6.39 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.6 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 2.0, 7.7 Hz, 1H), 7.72 (m, J_{AB} = 8.7 Hz, 2H), 8.25 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 4.8 Hz, 1H).	48.9	
化合物 245		M+H = 267, M-H = 265. mp 87.0-88.0 °C	61.2	16.0

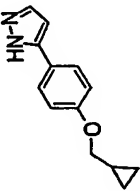
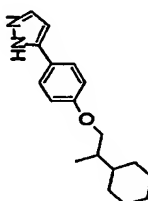
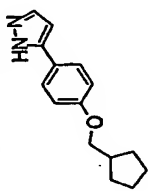
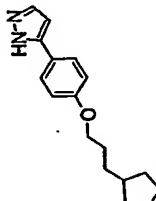
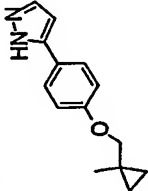
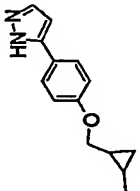
化合物 246		(200 MHz) δ 1.21 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 2.32 (s, 3H), 3.48 (q, $J = 7.3$ Hz, 2H), 3.74 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.17 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 6.50–6.60 (m, 3H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.08–7.18 (m, 1H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H). M+H = 323, M-H = 321.	56.1	3.8
化合物 247		mp 149.0–155.0 °C (dec.)		177.2
化合物 248		(200 MHz) δ 3.07 (s, 3H), 3.80 (t, $J = 5.9$ Hz, 2H), 4.20 (t, $J = 5.9$ Hz, 2H), 6.39 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 6.74–6.80 (m, 3H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.6$ Hz, 2H), 7.23–7.31 (m, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 8.7$ Hz, 2H), 8.26 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H). mp 72.0–76.0 °C		3.8
化合物 249		mp 193.0–195.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 250		mp 167.0–169.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 251		mp 188.0–189.0 °C (dec.)		>300

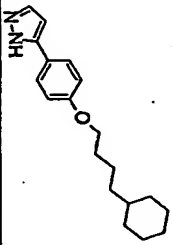
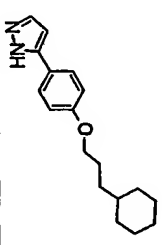
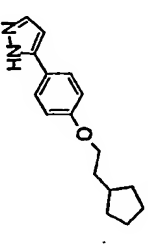
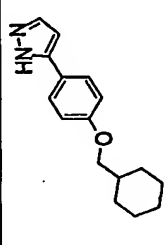
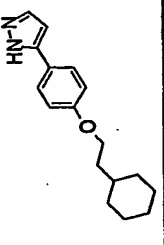
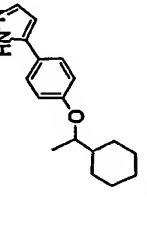
化合物 252		mp 212.0–213.0 °C (dec.)	17.5
化合物 253		mp 182.0–183.0 °C (dec.)	>300.0
化合物 254		DMSO- <i>d</i> ₆ , δ 1.09–1.27 (m, 2H), 1.74–2.00 (m, 6H), 3.07–3.58 (m, 6H), 4.52 (t, J = 5.4Hz, 2H), 6.92 (d, J = 1.9Hz, 1H), 7.16 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.86 (d, J = 9.0Hz, 2H), 8.61 (d, J = 2.0Hz, 1H).	>300.0
化合物 255		DMSO- <i>d</i> ₆ , δ 2.90 (s, 6H), 2.94 (s, 3H), 3.48–3.76 (m, 3H), 4.17 (m, 1H), 4.24–4.98 (m, 4H), 6.94 (d, J = 1.9Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.90 (d, J = 8.9Hz, 2H), 8.62 (d, J = 1.9Hz, 1H).	>300.0
化合物 256		mp 197.0–199.0 °C (dec.)	>300.0
化合物 257		mp 188.0–191.0 °C (dec.)	>300

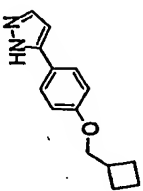
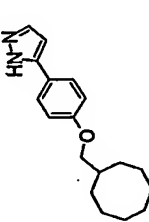
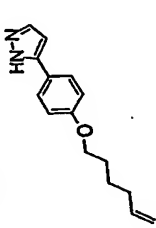
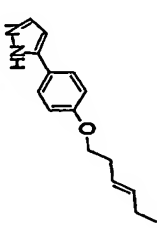
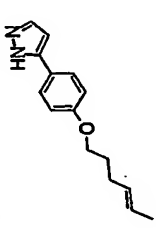
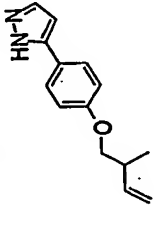
化合物 258	 HCl	mp 157.0–159.0 °C	>316.0
化合物 259	 HCl	mp 206.0–208.0 °C (dec.)	4.4
化合物 260	 2HCl	mp 252.0–253.0 °C (dec.)	15.6
化合物 261		mp 171.0–172.0 °C	>300.0
化合物 262		δ 0.90 (t, J = 6.6Hz, 3H), 1.23–1.52 (m, 8H), 1.80 (tt, J = 6.6, 6.6Hz, 2H), 3.99 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 259, M-H = 257.	64.5
化合物 263		δ 1.06 (t, J = 7.4Hz, 3H), 1.83 (tt, J = 6.6, 7.4Hz, 2H), 3.96 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 203, M-H = 201.	58.5

化合物 264		δ 0.91 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.09–1.92 (m, 7H), 3.99–4.06 (m, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 259, M-H = 257.	64.2	
化合物 265		δ 0.93 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 1.34–1.39 (m, 2H), 1.62 (septet, $J = 6.6$ Hz, 1H), 1.75–1.84 (m, 2H), 3.98 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.63 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 246, M-H = 243.	79.1	
化合物 266		δ 0.93 (t, $J = 7.2$ Hz, 6H), 1.30–1.75 (m, 8H), 4.24–4.32 (m, 1H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.93 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 259, M-H = 257.	27.9	
化合物 267		δ 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 1.70 (dt, $J = 6.6, 6.9$ Hz, 2H), 1.86 (septet, 1H), 4.03 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 231, M-H = 229.	56.8	
化合物 268		δ 0.99 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.51 (tt, $J = 7.2, 7.8$ Hz, 2H), 1.79 (tt, $J = 6.2, 7.8$ Hz, 2H), 4.00 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 217, M-H = 215. mp 72.0–76.0 °C	69.0	26.2
化合物 269		δ 1.00 (s, 9H), 1.75 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 4.06 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 245, M-H = 243.	56.7	

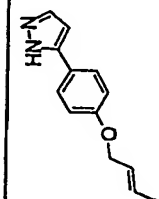
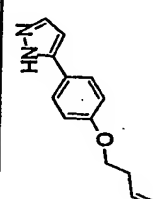
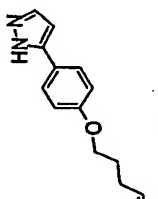
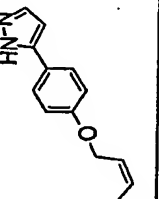
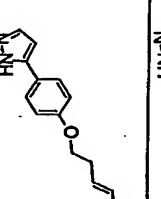
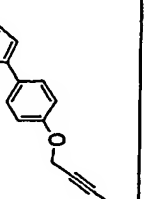
化合物 270		δ 1.04 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 6H), 2.10 (septet, $J = 6.6\text{Hz}$, 1H), 3.76 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 217, M-H = 215.	59.7	
化合物 271		δ 0.92 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 0.95 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 3H), 1.19-1.20 (m, 5H), 3.99-4.06 (m, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 245, M-H = 243.	71.7	
化合物 272		δ 0.94 (s, 9H), 1.08 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 3H), 1.11 (dd, $J = 6.0$, 14.0Hz, 2H), 1.40 (dd, $J = 3.8$, 14.0Hz, 2H), 1.98-2.03 (m, 1H), 3.68 (dd, $J = 7.5$, 8.8Hz, 1H), 3.81 (dd, $J = 6.0$, 8.8Hz, 1H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 273, M-H = 271.	66.7	
化合物 273		δ 0.92 (t, $J = 7.1\text{Hz}$, 6H), 1.21-1.49 (m, 8H), 1.78-1.88 (m, 1H), 3.87 (d, $J = 5.4\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 273, M-H = 271.	54.8	
化合物 274		δ 1.48-1.99 (m, 8H), 4.79 (tt, $J = 3.0$, 3.0Hz, 1H), 6.52 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.92 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.63 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	74.7	
化合物 275		δ 1.24-1.62 (m, 6H), 1.69-1.88 (m, 2H), 1.96-2.05 (m, 2H), 4.28 (tt, $J = 3.8$, 3.8Hz, 1H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.63 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 243, M-H = 241.	62.7	

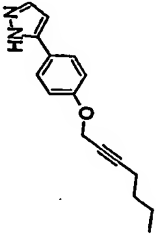
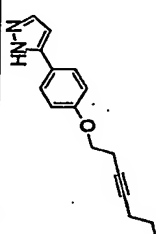
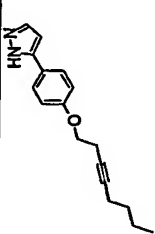
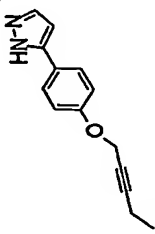
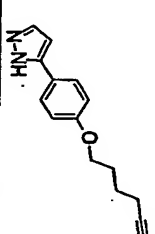
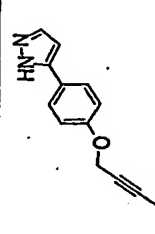
化合物 276		δ 0.34-0.40 (m, 2H), 0.62-0.70 (m, 2H), 0.72-0.89 (m, 1H), 3.84 (d, J = 7.2Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.59 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 215, M-H = 213.	71.1	
化合物 277		δ 1.00 (d, J = 6.6Hz, 3H), 0.98-1.86 (m, 12H), 3.79 (dd, J = 6.9, 9.0Hz, 1H), 3.96 (dd, J = 5.7, 9.0Hz, 1H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 285, M-H = 283.	47.1	
化合物 278		δ 1.22-1.93 (m, 8H), 2.38 (tt, J = 7.2, 7.2Hz, 1H), 4.07 (d, J = 7.2Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 243, M-H = 241.	77.5	
化合物 279		δ 1.08-1.89 (m, 13H), 3.99 (t, J = 6.6Hz, 2H), 6.50 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.56 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	61.3	
化合物 280		δ 0.45 (dd, J = 4.2, 6.0Hz, 2H), 0.56 (dd, J = 4.2, 6.0Hz, 2H), 1.25 (s, 3H), 3.77 (s, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	62.2	
化合物 281		δ 0.36-0.44 (m, 1H), 0.48-0.56 (m, 1H), 0.72-1.09 (m, 2H), 1.11 (d, J = 5.7Hz, 3H), 3.75-3.92 (m, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.64 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	68.2	

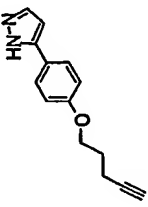
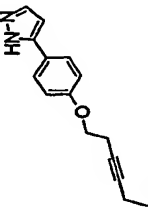
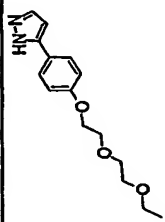
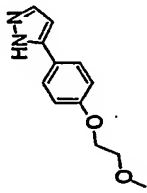
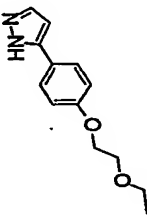
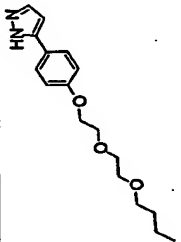
化合物 282		δ 0.80–1.80 (m, 17H), 3.99 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 300, M-H = 298.	21.3	
化合物 283		δ 0.80–1.85 (m, 15H), 3.97 (t, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 285, M-H = 283.	39.4	
化合物 284		δ 0.80–1.95 (m, 10H), 1.99 (dt, $J = 6.8, 8.1\text{Hz}$, 1H), 4.01 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 257, M-H = 255.	75.0	
化合物 285		δ 0.98–1.40 (m, 5H), 1.68–1.92 (m, 6H), 3.79 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 257, M-H = 255.	68.1	
化合物 286		δ 0.90–1.60 (m, 7H), 1.61–1.82 (m, 6H), 4.03 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	53.5	
化合物 287		δ 0.98–1.97 (m, 11H), 1.26 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 3H), 4.25 (dt, $J = 6.3, 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.93 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.63 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	37.0	

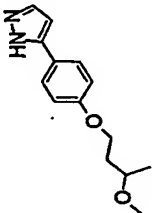
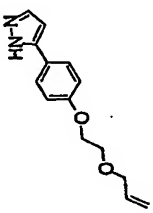
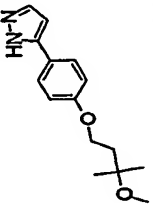
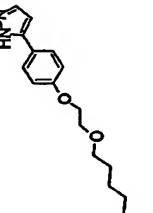
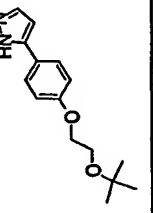
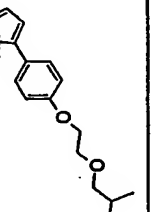
化合物 288		δ 1.83-2.10 (m, 6H), 2.70-2.81 (m, 1H), 3.97 (d, J = 6.9Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	52.4	
化合物 289		δ 1.24-1.84 (m, 14H), 2.00-2.10 (m, 1H), 3.76 (d, J = 6.6Hz, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 285, M-H = 283.	41.1	
化合物 290		δ 1.52-1.64 (m, 2H), 1.78-1.90 (m, 2H), 2.12-2.19 (m, 2H), 4.00 (t, J = 6.8Hz, 2H), 4.94-5.10 (m, 2H), 5.79-5.91 (m, 1H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 243, M-H = 241.	60.8	
化合物 291		δ 0.99 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.05 (m, 2H), 2.51 (m, 2H), 4.01 (t, J = 8.8Hz, 2H), 5.52 (m, 1H), 5.61 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 243, M-H = 241.	55.4	
化合物 292		δ 1.66 (d, J = 4.8Hz, 3H), 1.85 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 3.99 (t, J = 6.6Hz, 2H), 5.47 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.94 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 243, M-H = 241.		
化合物 293		δ 1.16 (d, J = 6.9Hz, 3H), 2.70 (m, 1H), 3.84 (dd, J = 6.9, 9.0Hz, 1H), 3.93 (dd, J = 6.3, 9.0Hz, 1H), 5.08-5.19 (m, 2H), 5.89 (m, 1H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	52.3	

化合物 294		δ 1.67 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.51 (dt, $J = 6.9$, 6.9Hz, 2H), 3.97 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.23 (tq, $J = 1.2$, 6.9Hz, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 243, M-H = 241.	66.2
化合物 295		δ 2.94 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 4.63 (dd, $J = 1.8$, 5.1Hz, 2H), 5.87 (ddt, $J = 1.8$, 2.0, 16.0Hz, 1H), 6.42 (dt, $J = 5.1$, 16.0Hz, 1H), 6.55 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.67 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 225, M-H = 223.	63.5
化合物 296		δ 1.82(s, 3H), 2.53 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.12 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.82 (s, 1H), 4.86 (s, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	81.1
化合物 297		δ 0.91 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 1.30-1.39 (m, 4H), 2.10 (m, 2H), 2.56 (m, 2H), 4.00 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 5.51 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	58.6
化合物 298		δ 0.97 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.54 (m, 2H), 1.82 (m, 2H), 2.00-2.16 (m, 4H), 4.00 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 5.33-5.45 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	55.1
化合物 299		δ 1.47-1.50 (m, 4H), 1.81 (m, 2H), 2.09 (m, 2H), 3.99 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 4.92-5.06 (m, 2H), 5.81 (m, 1H), 6.53 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 257, M-H = 255.	60.7

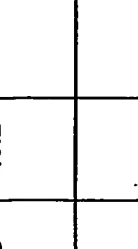
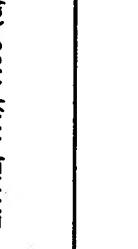
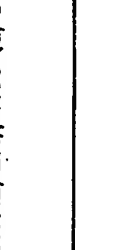
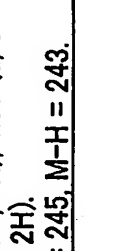
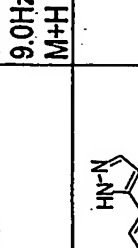

化合物 300		δ 1.77 (dd, $J = 1.2, 6.3\text{Hz}$, 3H), 4.49 (dd, $J = 1.1, 5.0\text{Hz}$, 2H), 5.77 (m, 1H), 5.86 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 215.	52.5
化合物 301		δ 2.57 (m, 2H), 4.06 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 5.11-5.23 (m, 2H), 5.92 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 215, M-H = 213.	53.0
化合物 302		δ 1.91 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 4.01 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 4.98-5.12 (m, 2H), 5.86 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 229, M-H = 227.	62.4
化合物 303		δ 1.04 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.17 (m, 2H), 4.62 (d, $J = 5.1\text{Hz}$, 2H), 5.62-5.72 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 229.	60.7
化合物 304		δ 0.93 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.43 (m, 2H), 2.07 (m, 2H), 2.57 (q, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.00 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 5.46-5.59 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 257, M-H = 255.	48.9
化合物 305		δ 0.96 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.53 (qt, $J = 7.2, 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.21 (tt, $J = 2.2, 7.2\text{Hz}$, 2H), 4.71 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 6.55 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.67 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 241, M-H = 239.	36.8

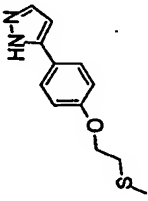
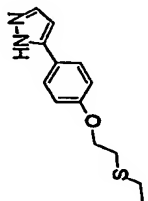
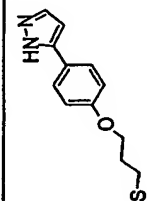
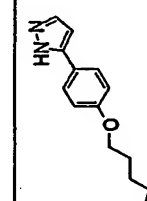
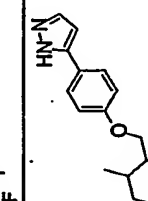
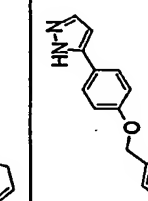
化合物 306		δ 0.89 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.34–1.53 (m, 4H), 2.23 (m, 2H), 4.71 (t, $J = 2.1\text{Hz}$, 2H), 6.55 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.67 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 255, M-H = 253.	53.9	
化合物 307		δ 0.98 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.52 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.67 (m, 2H), 4.09 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 6.55 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 255, M-H = 253.	57.5	
化合物 308		δ 0.91 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.26–1.61 (m, 4H), 2.17 (m, 2H), 2.66 (m, 2H), 4.09 (t, $J = 7.4\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 269, M-H = 267.	52.3	
化合物 309		δ 1.15 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.25 (m, 2H), 4.71 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 7.03 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.67 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 227, M-H = 225.	40.5	
化合物 310		δ 1.75 (m, 2H), 1.93 (m, 2H), 1.98 (s, 1H), 2.29 (m, 2H), 4.03 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.94 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 241, M-H = 239.	72.9	
化合物 311		δ 1.87 (t, $J = 2.4\text{Hz}$, 3H), 4.69 (q, $J = 2.4\text{Hz}$, 2H), 6.56 (s, 1H), 7.02 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.68 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 213, M-H = 211.	58.9	

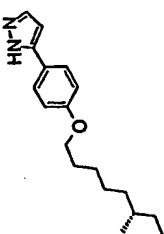
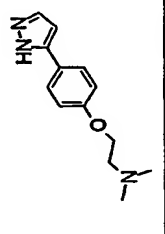
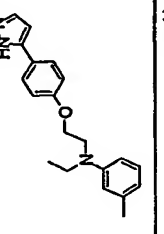
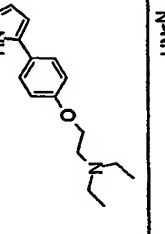
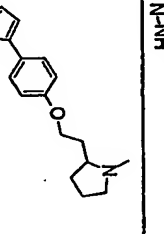
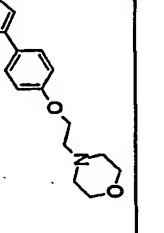
化合物 312		δ 1.98 (s, 1H), 2.03 (m, 2H), 2.43 (m, 2H), 4.14 (t, $J = 6.0\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 227, M-H = 225.	74.5
化合物 313		δ 1.13 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 2.19 (m, 2H), 2.66 (m, 2H), 4.09 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 6.55 (s, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 241, M-H = 239.	73.5
化合物 314		δ 1.22 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 3H), 3.54 (m, 2H), 3.63 (m, 2H), 3.74 (m, 2H), 3.89 (t, $J = 5.0\text{Hz}$, 2H), 4.18 (t, $J = 5.0\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 277, M-H = 275.	49.7
化合物 315		δ 3.47 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 6.99 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 219, M-H = 217.	61.6
化合物 316		δ 1.26 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 3H), 3.62 (m, 2H), 3.82 (m, 2H), 4.17 (m, 2H), 6.55 (s, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 233, M-H = 231.	42.1
化合物 317		δ 0.91 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.35 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 3.48 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.73 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.17 (m, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 305, M-H = 303.	56.3

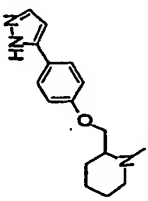
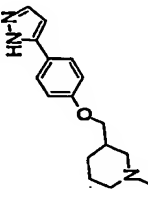
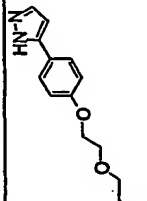
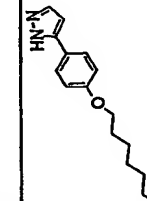
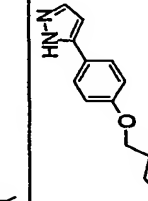
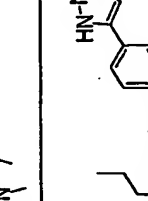
化合物 318		δ 1.22 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 3H), 1.95 (m, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.58 (m, 1H), 4.09 (m, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.96 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 247, M-H = 245.	69.7	
化合物 319		δ 3.83 (m, 2H), 4.09-4.20 (m, 4H), 5.20-5.38 (m, 2H), 5.95 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 6.98 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 245, M-H = 243.	50.0	
化合物 320		δ 1.26 (s, 6H), 2.02 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.23 (s, 3H), 4.11 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 261, M-H = 259.	74.5	
化合物 321		δ 0.89 (t, $J = 6.6\text{Hz}$, 3H), 1.24-1.39 (m, 6H), 1.60 (m, 2H), 3.54 (t, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.16 (t, $J = 4.5\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.98 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.64 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H). M+H = 289, M-H = 287.	60.8	
化合物 322		δ 1.25 (s, 9H), 3.74 (t, $J = 5.4\text{Hz}$, 2H), 4.12 (t, $J = 5.4\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.97 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 261, M-H = 259.	51.0	
化合物 323		δ 0.92 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 6H), 1.91 (septet, $J = 6.6\text{Hz}$, 1H), 3.31 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 3.80 (t, $J = 4.8\text{Hz}$, 2H), 4.18 (t, $J = 4.8\text{Hz}$, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.98 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 261, M-H = 259.	52.4	

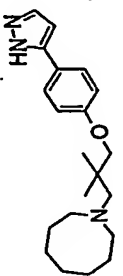
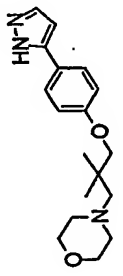
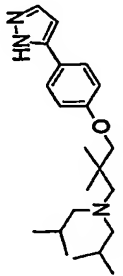
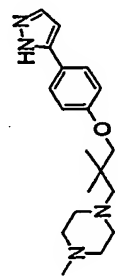
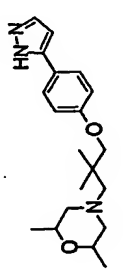
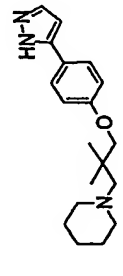
化合物 324		δ 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.63 (tq, J = 6.8, 7.5Hz, 2H), 3.51 (t, J = 6.8Hz, 2H), 3.81 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.53 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 247, M-H = 245.	47.4
化合物 325		δ 1.76-1.92 (m, 4H), 3.36 (s, 3H), 3.46 (t, J = 6.3Hz, 2H), 4.02 (t, J = 6.3Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 247, M-H = 245.	58.4
化合物 326		δ 0.90 (d, J = 6.6Hz, 6H), 1.88 (septet, J = 6.6Hz, 1H), 3.24 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.73 (m, 2H), 3.89 (m, 2H), 4.17 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.59 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 305, M-H = 303.	40.1
化合物 327		δ 3.40 (s, 3H), 3.591 (m, 2H), 3.74 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.97 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 263, M-H = 261.	39.7
化合物 328		δ 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.39 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 3.55 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.54 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.98 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 261, M-H = 259.	55.2
化合物 329		δ 1.21 (d, J = 6.0Hz, 6H), 3.70 (septet, J = 6.0Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 247, M-H = 245.	47.9

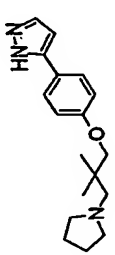
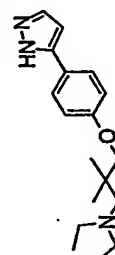
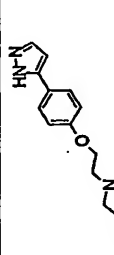
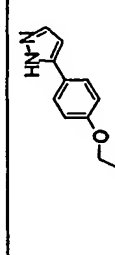
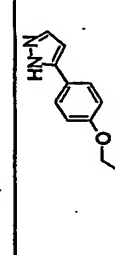
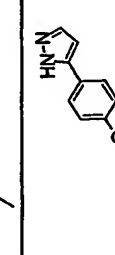
化合物 330		δ 0.88 (t, J = 6.3Hz, 3H), 1.21-1.39 (m, 8H), 1.60 (m, 2H), 3.54 (t, J = 6.8Hz, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.54 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.98 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 303, M-H = 301.	47.8
化合物 331		δ 0.90 (t, J = 6.6Hz, 3H), 1.23-1.47 (m, 4H), 1.63 (m, 2H), 3.54 (t, J = 6.6Hz, 2H), 3.80 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 275, M-H = 273.	60.7
化合物 332		δ 0.89 (t, J = 7.0Hz, 3H), 1.24-1.35 (m, 4H), 1.59 (m, 2H), 3.47 (t, J = 6.8Hz, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.73 (m, 2H), 3.88 (m, 2H), 4.17 (m, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 319, M-H = 317.	59.6
化合物 333		δ 3.82 (s, 3H), 4.68 (s, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.97 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.68 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 233.	40.3
化合物 334		δ 1.75-2.13 (m, 4H), 3.80-4.00 (m, 2H), 4.00 (m, 2H), 4.28 (m, 1H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.65 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 245, M-H = 243.	49.2
化合物 335		δ 3.90 (m, 1H), 4.00-4.13 (m, 3H), 4.45 (m, 1H), 4.95 (s, 1H), 5.11 (s, 1H), 6.55 (s, 1H), 6.97 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.68 (d, J = 8.90Hz, 2H). M+H = 247, M-H = 245.	52.2

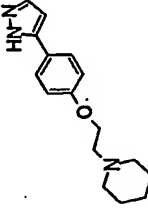
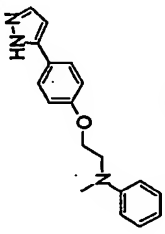
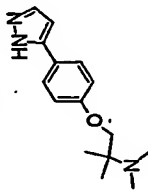
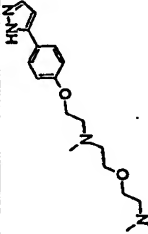
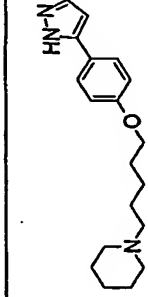
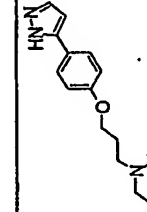
化合物 336		δ 2.23 (s, 3H), 2.91 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 4.20 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 6.55 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H). M+H = 235, M-H = 233.	37.1	
化合物 337		δ 1.31 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H), 2.67 (q, $J = 7.4$ Hz, 2H), 2.93 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 4.18 (t, $J = 6.9$ Hz, 2H), 6.54 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 249, M-H = 247.	37.4	
化合物 338		δ 2.08 (quint, $J = 6.2$ Hz, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.71 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.11 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 6.54 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 249, M-H = 247.	59.1	
化合物 339		δ 2.07 (m, 2H), 2.34 (m, 2H), 4.06 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 6.54 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 271, M-H = 269.	74.9	
化合物 340		δ 1.03 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 1.79-2.32 (m, 6H), 3.94 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 5.68 (m, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 269, M-H = 267.	62.3	
化合物 341		δ 5.11 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.03 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.31-7.48 (m, 5H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.67 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 251.	69.4	

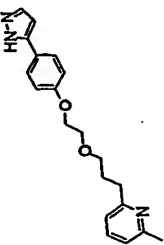
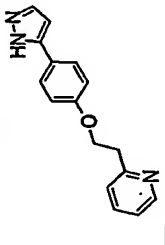
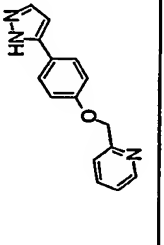
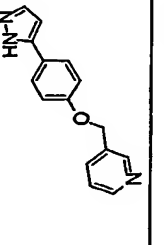
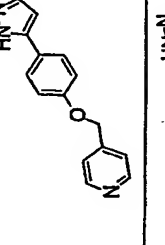
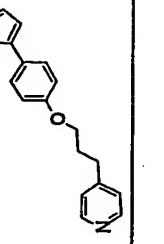
化合物 342		δ 0.86 (d, $J = 6.3\text{Hz}$, 3H), 0.86 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.09-1.47 (m, 9H), 1.79 (m, 2H), 3.99 (t, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 287, M-H = 285.	42.6	
化合物 343		δ 2.36 (s, 3H), 2.76 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 4.11 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 232, M-H = 230.	24.8	
化合物 344		δ 1.20 (t, $J = 6.9\text{Hz}$, 3H), 2.31 (s, 3H), 3.47 (q, $J = 6.9\text{Hz}$, 2H), 3.73 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 3H), 4.15 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, 1H, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.50-6.57 (m, 2H), 6.93 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.12 (dd, $J = 1.8$, 7.5Hz, 1H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 322, M-H = 320.	66.2	
化合物 345		δ 1.08 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.66 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.90 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 4.09 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 260, M-H = 258.	24.1	
化合物 346		δ 1.50-2.65 (m, 7H), 2.36 (s, 3H), 3.10 (dt, $J = 2.1$, 7.2Hz, 2H), 4.05 (d, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 272, M-H = 270.	34.4	
化合物 347		δ 2.60 (t, $J = 4.7\text{Hz}$, 4H), 2.83 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 3.75 (t, $J = 4.7\text{Hz}$, 4H), 4.15 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 6.54 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 274, M-H = 272.	42.9	

化合物 348		δ 1.48-2.95 (m, 9H), 2.42 (s, 3H), 4.03 (dd, $J = 4.4\text{Hz}$, 1H), 4.04 (dd, $J = 4.4\text{Hz}$, 1H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.95 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 272, M-H = 270.	3.8	
化合物 349		δ 1.55-2.30 (m, 7H), 2.29 (s, 3H), 2.73-2.81 (m, 1H), 2.95-3.01 (m, 1H), 3.80-3.92 (m, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.94 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 272, M-H = 270.	49.9	
化合物 350		δ 1.04 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.60 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.71 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 3.66 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 3.84 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 304, M-H = 302.	29.7	
化合物 351		δ 1.20-1.58 (m, 6H), 1.81 (m, 2H), 2.23 (s, 6H), 2.28 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.99 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 288, M-H = 286.	76.3	
化合物 352		δ 1.01 (s, 6H), 2.29 (s, 6H), 2.36 (s, 2H), 3.74 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 6.96 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.1\text{Hz}$, 1H), 7.63 (d, $J = 8.7\text{Hz}$, 2H). M+H = 274, M-H = 272.		
化合物 353		δ 0.79 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 6H), 0.97 (s, 6H), 1.30-1.48 (m, 4H), 2.35-2.41 (m, 6H), 3.70 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 6.94 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 2.4\text{Hz}$, 1H), 7.63 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H). M+H = 330, M-H = 328.	23.7	

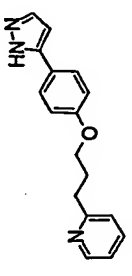
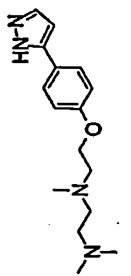
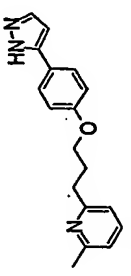
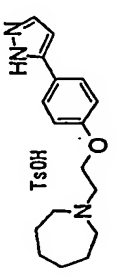
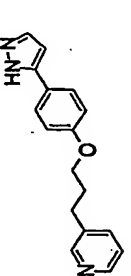
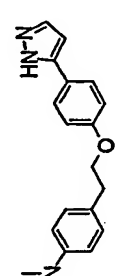
化合物 354		δ 0.99 (s, 6H), 1.42-1.70 (m, 10H), 2.49 (s, 2H), 2.60-2.74 (m, 4H), 3.76 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 330, M-H = 328.	86.1
化合物 355		δ 0.99 (s, 6H), 2.31 (s, 2H), 2.50 (t, $J = 4.5$ Hz, 4H), 3.62 (t, $J = 4.5$ Hz, 4H), 3.72 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 316, M-H = 314.	64.6
化合物 356		δ 0.83 (d, $J = 6.6$ Hz, 12H), 1.00 (s, 6H), 1.67 (m, 2H), 2.10 (d, $J = 7.2$ Hz, 4H), 2.34 (s, 2H), 3.73 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H). M+H = 358, M-H = 359.	34.8
化合物 357		δ 0.97 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.32 (s, 2H), 2.37 (m, 4H), 2.55 (t, $J = 5.0$ Hz, 4H), 3.71 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H). M+H = 329, M-H = 327.	36.2
化合物 358		δ 0.98 (s, 6H), 1.07 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H), 2.00 (d, $J = 11.4$ Hz, 2H), 2.28 (s, 2H), 2.58 (d, $J = 11.4$ Hz, 2H), 3.55-3.64 (m, 2H), 3.72 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.60 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 344, M-H = 342.	55.5
化合物 359		δ 0.97 (s, 6H), 1.26-1.56 (m, 6H), 2.24 (s, 2H), 2.39-2.45 (m, 4H), 3.71 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 314, M-H = 312.	11.2

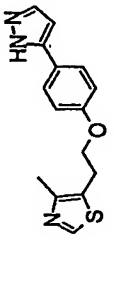
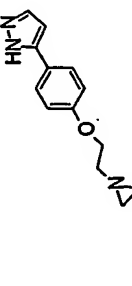
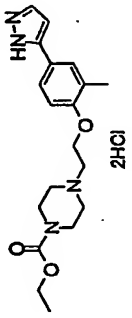
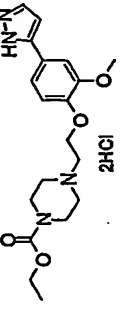
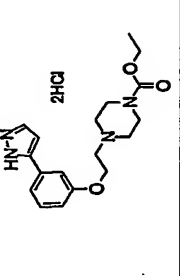
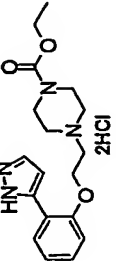
化合物 360		δ 1.03 (s, 6H), 1.61–1.90 (m, 4H), 2.49 (s, 2H), 2.53–2.68 (m, 4H), 3.75 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 300, M-H = 298.	13.5
化合物 361		δ 0.94 (t, $J = 7.2$ Hz, 6H), 0.98 (s, 6H), 2.36 (s, 2H), 2.51 (q, $J = 7.2$ Hz, 4H), 3.70 (s, 2H), 6.53 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.63 (d, $J = 8.7$ Hz, 2H). M+H = 302, M-H = 300.	22.5
化合物 362		δ 2.36 (s, 3H), 2.85 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 3.63 (s, 2H), 4.13 (t, $J = 6.0$ Hz, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.94 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.20–7.38 (m, 5H), 7.59 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 308, M-H = 306.	45.7
化合物 363		δ 1.98 (tt, $J = 6.5, 7.4$ Hz, 2H), 2.27 (s, 6H), 2.48 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 4.05 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 8.9$ Hz, 2H). M+H = 246, M-H = 244.	47.5
化合物 364		δ 1.04 (t, $J = 7.1$ Hz, 6H), 1.95 (tt, $J = 6.5, 7.4$ Hz, 2H), 2.56 (q, $J = 7.1$ Hz, 4H), 2.63 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 4.04 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 6.95 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 274, M-H = 272.	59.3
化合物 365		δ 1.72–1.89 (m, 4H), 2.60–2.71 (m, 4H), 2.93 (t, $J = 5.9$ Hz, 2H), 4.15 (t, $J = 5.9$ Hz, 2H), 6.53 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 6.96 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 9.0$ Hz, 2H). M+H = 258, M-H = 256.	17.8

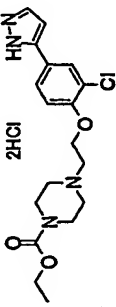
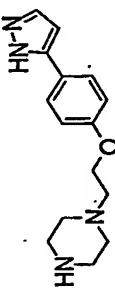
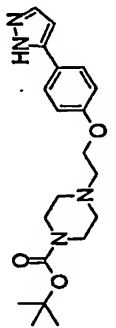
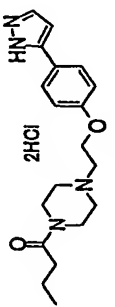
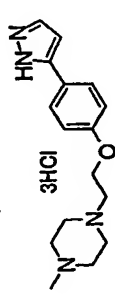
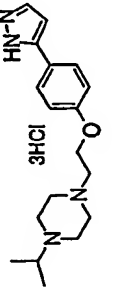
化合物 366		δ 1.38–1.68 (m, 6H), 2.38–2.59 (m, 4H), 2.80 (t, J = 6.0Hz, 2H), 4.15 (t, J = 6.0Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.59 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 272, M–H = 270.	24.2
化合物 367		δ 3.06 (s, 3H), 3.77 (t, J = 6.0Hz, 2H), 4.17 (t, J = 6.0Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.69–6.70 (m, 3H), 6.92 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.20–7.29 (m, 2H), 7.59 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 294, M–H = 292.	86.8
化合物 368		δ 1.20 (s, 6H), 2.37 (s, 6H), 3.78 (s, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 260, M–H = 258.	22.6
化合物 369		δ 2.26 (s, 6H), 2.40 (s, 3H), 2.51 (t, J = 6.0Hz, 2H), 2.73 (t, J = 6.0Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.54 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.58 (t, J = 6.0Hz, 2H), 4.12 (t, J = 6.0Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.59 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.9Hz, 2H). M+H = 333, M–H = 331.	22.1
化合物 370		δ 1.20–1.68 (m, 12H), 2.28–2.43 (m, 6H), 3.64 (t, J = 6.5Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.94 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.59 (d, J = 2.3Hz, 2H), 7.64 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 314, M–H = 312.	47.2
化合物 371		δ 1.40–1.62 (m, 6H), 2.00 (m, 2H), 2.31–2.58 (m, 6H), 4.04 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.7Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.7Hz, 2H). M+H = 286, M–H = 284.	18.9

化合物 372		δ 2.04 (tt, $J = 6.5, 7.8\text{Hz}, 2\text{H}$), 2.53 (s, 3H), 2.84 (t, $J = 7.8\text{Hz}, 2\text{H}$), 3.58 (t, $J = 6.5\text{Hz}, 2\text{H}$), 3.80 (m, 2H), 4.15 (m, 2H), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 6.93–7.00 (m, 2H), 6.97 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.45 (t, $J = 7.7\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.60 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.66 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$). M+H = 338, M–H = 336.	0.0	
化合物 373		δ 3.29 (t, $J = 6.8\text{Hz}, 2\text{H}$), 4.41 (t, $J = 6.8\text{Hz}, 2\text{H}$), 6.53 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 6.95 (d, $J = 8.9\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.13–7.19 (m, 1H), 7.26–7.30 (m, 1H), 7.59 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.60–7.66 (m, 1H), 7.64 (d, $J = 8.9\text{Hz}, 2\text{H}$), 8.55–8.59 (m, 1H). M+H = 266, M–H = 264.	79.0	
化合物 374		δ 5.25 (s, 2H), 6.54 (d, $J = 2.1\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.04 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.21–7.27 (m, 1H), 7.53 (d, $J = 7.8\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.59 (d, $J = 2.1\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.67 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.72 (dt, $J = 1.8, 7.8\text{Hz}, 1\text{H}$), 8.60–8.63 (m, 1H). M+H = 252, M–H = 250.	63.9	
化合物 375		δ 5.13 (s, 2H), 6.56 (d, $J = 2.1\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.03 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.34 (dd, $J = 4.8, 7.8\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.61 (d, $J = 2.1\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.70 (d, $J = 7.8\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.80 (d, $J = 7.8\text{Hz}, 1\text{H}$), 8.60 (d, $J = 4.8\text{Hz}, 1\text{H}$), 8.71 (s, 1H). M+H = 252, M–H = 250.	91.0	
化合物 376		δ 5.14 (s, 2H), 6.55 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.01 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.37 (d, $J = 6.3\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.61 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.70 (d, $J = 9.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 8.63 (d, $J = 6.3\text{Hz}, 2\text{H}$). M+H = 252, M–H = 250.	81.7	
化合物 377		δ 2.14 (tt, $J = 6.0, 7.6\text{Hz}, 2\text{H}$), 2.84 (t, $J = 7.6\text{Hz}, 2\text{H}$), 4.01 (t, $J = 6.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 6.54 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 6.93 (d, $J = 8.7\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.16 (d, $J = 6.0\text{Hz}, 2\text{H}$), 7.60 (d, $J = 2.3\text{Hz}, 1\text{H}$), 7.67 (d, $J = 8.7\text{Hz}, 2\text{H}$), 8.51 (d, $J = 6.0\text{Hz}, 2\text{H}$). M+H = 280, M–H = 278.	88.0	

化合物 378		δ 4.21–4.34 (m, 4H), 6.18 (t, J = 2.2Hz, 2H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.78 (t, J = 2.2Hz, 2H), 6.91 (d, J = 8.6Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.6Hz, 2H). M+H = 254, M+Na = 276, M-H = 252. mp 129.0–130.0°C	6.1
化合物 379		δ 2.23 (m, 2H), 3.94 (t, J = 5.9Hz, 2H), 4.12 (t, J = 6.8Hz, 2H), 6.15 (t, J = 2.0Hz, 2H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.66 (t, J = 2.0Hz, 2H), 6.94 (d, J = 8.5Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.5Hz, 2H). M+Na = 290, M-H = 266. mp 94.0–97.5°C	22.4
化合物 380		δ 4.39 (t, J = 6.0Hz, 2H), 4.75 (t, J = 6.0Hz, 2H), 6.52 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.6Hz, 2H), 7.22–7.30 (m, 2H), 7.45–7.64 (m, 7H), 8.11 (d, J = 7.7Hz, 2H). M+H = 354, M+Na = 376, M-H = 352. mp 199.5–200.5°C.	16.2
化合物 381		mp 217.0–218.0 °C (dec.)	7.1
化合物 382		DMSO- d_6 , δ 2.38 (s, 3H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.20–7.40 (m, 4H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.81 (d, J = 8.4Hz, 2H). M+H = 381, M+Na = 403, M-H = 379.	38.2
化合物 383		δ 1.60–1.91 (m, 4H), 2.25 (s, 6H), 2.34 (t, J = 7.3Hz, 2H), 4.02 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.6Hz, 2H). M+H = 260, M+Na = 282, M-H = 258. mp 76.0–78.0°C.	111.4

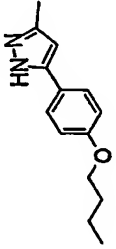
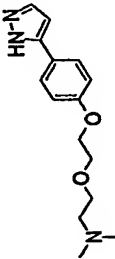
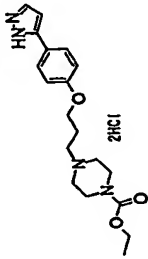
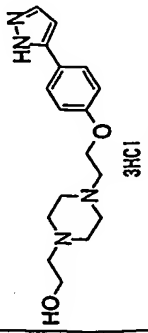
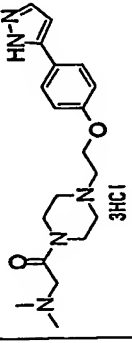
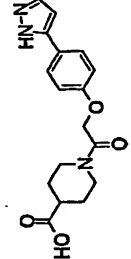
化合物 384		δ 2.27 (m, 2H), 3.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 4.05 (t, J = 6.4Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.11-7.22 (m, 3H), 7.61 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.57-7.68 (m, 3H), 8.55 (m, 1H). M+Na = 302, M-H = 278. mp 112.0-113.0°C.	80.3	5.2
化合物 385		δ 2.30 (s, 6H), 2.39 (s, 3H), 2.49 (m, 2H), 2.65 (m, 2H), 2.87 (t, J = 5.9Hz, 2H), 4.13 (t, J = 5.9Hz, 2H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.96 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.8Hz, 2H). M+H = 289, M+Na = 311, M-H = 287. mp 38.5-41.0°C.	20.3	>300
化合物 386		δ 2.25 (m, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.97 (t, J = 7.5Hz, 2H), 4.05 (t, J = 6.4Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.73-7.01 (m, 4H), 7.50 (t, J = 7.5Hz, 1H), 7.61 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.6Hz, 2H). M+Na = 316, M-H = 292. mp 126.0-126.5°C.	73.1	3.5
化合物 387		DMSO- d_6 , δ 1.55-1.92 (m, 8H), 2.29 (s, 3H), 3.18-3.60 (m, 6H), 4.37 (brt, J = 5.0Hz, 2H), 6.64 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.05 (d, J = 9.0Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.48 (d, J = 8.1Hz), 7.68 (brd, J = 2.2Hz, 1H), 7.77 (d, J = 9.0Hz, 2H). M+H = 286.	38.7	224
化合物 388		2.2Hz, 1H), 6.95 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.22 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.8Hz, 2H), 8.47 (dd, J = 1.5, 4.8Hz, 1H), 8.51 (d, J = 2.2Hz, 1H). M+H = 280, M+Na = 302, M-H = 278. mp 75.0-78.0°C.	87.6	1.4
化合物 389		δ 2.94 (s, 6H), 3.02 (t, J = 7.3Hz, 2H), 4.16 (t, J = 7.3Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.74 (d, J = 8.8Hz, 2H), 6.96 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.8Hz), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.8Hz, 2H). M+Na = 330, M-H = 306. mp 112.5-113.5°C.	68.9	5.7

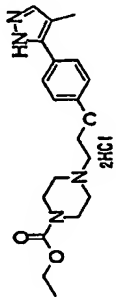
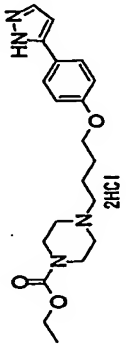
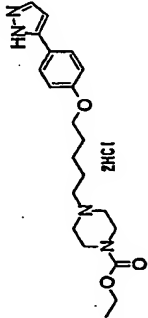
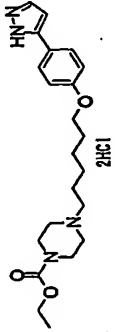
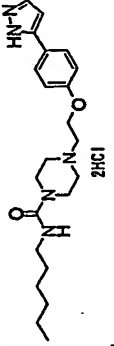
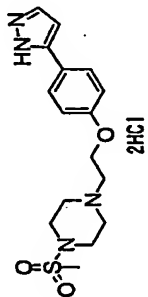
化合物 390		δ 2.47 (s, 3H), 3.27 (t, J = 6.5Hz, 2H), 4.19 (t, J = 6.5Hz, 2H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.96 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.61 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.8Hz, 2H), 8.62 (s, 1H). M+Na = 308, M-H = 284. mp 157.0–158.0°C.	95.1	2.4
化合物 391		δ 1.27 (m, 2H), 1.83 (m, 2H), 2.65 (t, J = 5.7Hz, 2H), 4.18 (t, J = 5.7Hz, 2H), 6.45 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.8Hz, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.8Hz, 2H).		
化合物 392		DMSO- d_6 , δ 1.21 (t, J = 7.2Hz, 3H), 2.24 (s, 3H), 3.10–3.45 (m, 4H), 3.50–3.65 (m, 4H), 4.03–4.16 (m, 4H), 4.44 (t, J = 4.5Hz, 2H), 6.64 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.01 (d, J = 8.2Hz, 2H), 7.58–7.65 (m, 2H), 7.70 (d, J = 2.2Hz, 1H). mp 203.5–204.5°C.		3.2
化合物 393		DMSO- d_6 , δ 1.21 (t, J = 7.2Hz, 3H), 3.08–3.25 (m, 2H), 3.28–3.45 (m, 2H), 3.51–3.68 (m, 4H), 3.86 (s, 3H), 4.00–4.15 (m, 4H), 4.44 (brt, J = 4.8Hz, 2H), 6.75 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.2Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 1.9, 8.2Hz, 1H), 7.49 (d, J = 1.9Hz, 1H), 7.77 (d, J = 2.2Hz, 1H). mp 189.5–191.0 °C		>300.0
化合物 394		DMSO- d_6 , δ 1.21 (t, J = 7.2Hz, 3H), 3.17 (m, 2H), 3.35 (m, 2H), 3.56 (m, 4H), 4.05–4.10 (m, 2H), 4.08 (q, J = 7.2Hz, 2H), 4.48 (t, J = 5.0Hz, 2H), 6.74 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 1.6, 8.0Hz, 1H), 7.36 (t, J = 8.0Hz, 1H), 7.44–7.46 (m, 2H), 7.74 (d, J = 2.2Hz, 1H).		>300.0
化合物 395		DMSO- d_6 , δ 1.20 (t, J = 7.2Hz, 3H), 3.64 (brt, J = 4.8Hz, 2H), 4.08 (q, J = 7.2Hz, 2H), 4.56 (brt, J = 4.8Hz, 2H), 6.81 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.20 (d, J = 7.7Hz, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.79 (dd, J = 1.8, 7.7Hz, 1H), 7.84 (d, J = 2.2Hz, 1H).		>300.0

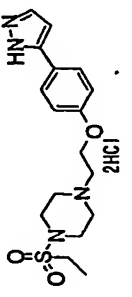
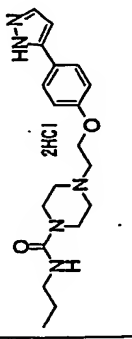
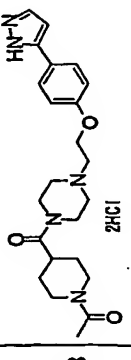
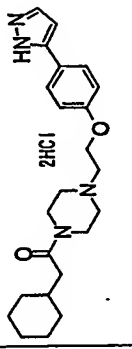
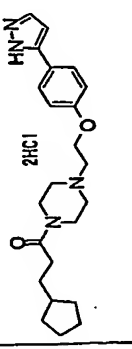
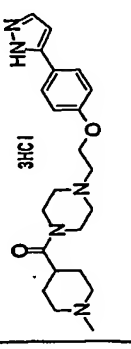
化合物 396		DMSO-d ₆ , δ 1.21 (t, J = 7.2Hz, 3H), 3.13-3.48 (m, 4H), 3.53-3.66 (m, 4H), 4.00-4.14 (m, 4H), 4.57 (brt, J = 4.8Hz, 2H), 6.76 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.26 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.75 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 2.2, 8.5Hz, 1H), 7.91 (d, J = 2.0Hz, 1H). mp 202.0-203.0 °C	85.6
化合物 397		δ 2.55-2.59 (m, 4H), 2.82 (t, J = 5.9Hz, 2H), 2.91-2.96 (m, 4H), 4.15 (t, J = 5.9Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.2Hz, 1H), 6.96 (m, 2H), 7.60 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66 (m, 2H). mp 148.0-151.0 °C	>300.0
化合物 398		δ 1.46 (s, 9H), 2.53-2.56 (m, 4H), 2.84 (t, J = 5.8Hz, 2H), 3.45-3.48 (m, 4H), 4.15 (t, J = 5.8Hz, 2H), 6.53 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.96 (m, 2H), 7.60 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.67 (m, 2H).	>300.0
化合物 399		δ 0.97 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.66 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.54-2.64 (m, 4H), 2.85 (t, J = 5.6Hz, 2H), 3.51 (t, J = 5.0Hz, 2H), 3.67 (t, J = 5.0Hz, 2H), 4.15 (t, J = 5.6Hz, 2H), 6.54 (d, J = 2.3Hz, 1H), 6.95 (m, 2H), 7.60 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.67 (m, 2H). mp 204.0-207.0 °C (dec.)	14.0
化合物 400		mp 159.0-163.0 °C	>300.0
化合物 401		mp 215.0-220.0 °C (dec.)	>300.0

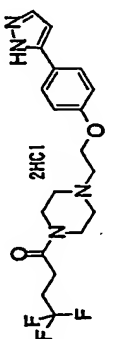
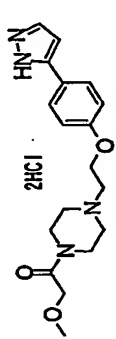
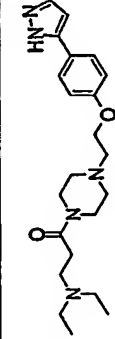
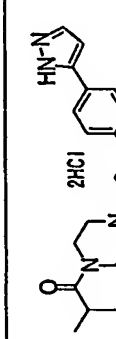
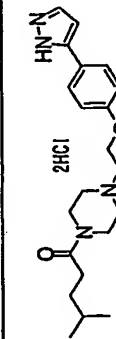
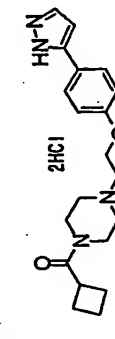
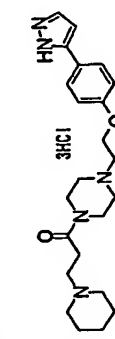
化合物 402	 2HCl			mp 221.5–225.0 °C (dec.)	22.4
化合物 403	 4HCl			mp 245.0–246.0 °C	144.8
化合物 404	 4HCl			mp 161.0–164.5 °C (dec.)	86.1
化合物 405	 2HCl			mp 138.0–144.0 °C DMSO-d ₆ , δ 1.34 (t, J = 7.0Hz, 3H), 4.37 (q, J = 7.0Hz, 2H), 5.32 (s, 2H), 6.61 (m, 1H), 7.07 (m, 2H), 7.68–7.73 (m, 4H), 8.34 (m, 1H), 9.10 (d, J = 2.2Hz, 1H). M+H = 324, M+Na = 346, M-H = 322.	>300.0
化合物 406				mp 177.0–178.0 °C	22.0
化合物 407				mp = 167.0–169.0 °C	159.4

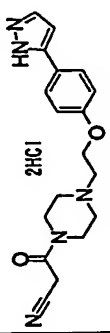
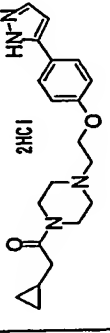
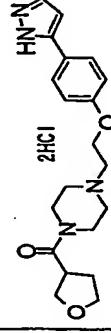
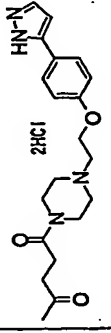
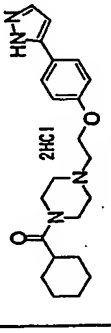
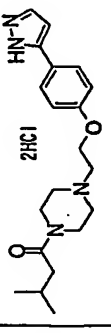
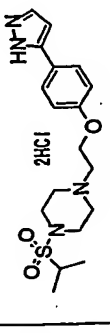
化合物 408		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 5.28 (s, 2H), 6.61 (d, J = 2.0Hz, 1H), 7.08 (brd, J = 8.6Hz, 2H), 7.62 (d, J = 8.6Hz, 2H), 7.71–7.75 (m, 2H), 8.25 (dd, J = 2.2, 8.1Hz, 1H), 9.03 (d, J = 1.5Hz, 1H). M+Na = 318, M-H = 294. mp 237.0–242.0°C	17.5
化合物 409		δ 1.26 (t, J = 7.2Hz, 3H), 2.41 (t, J = 4.8Hz, 4H), 3.48 (t, J = 4.8Hz, 4H), 3.53 (s, 2H), 4.13 (q, J = 7.2Hz, 2H), 5.24 (s, 2H), 6.55 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.04 (m, 2H), 7.50 (d, J = 7.9Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.66–7.72 (m, 3H), 8.53 (d, J = 1.4Hz, 1H). mp 113.0–117.0°C	>300.0
化合物 410		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 2.71 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 4.39 (d, J = 5.3Hz, 2H), 5.33 (s, 2H), 6.74 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.14 (m, 2H), 7.74 (d, J = 8.0Hz, 1H), 7.80 (m, 2H), 7.82 (d, J = 2.3Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 2.2, 8.1Hz, 1H), 8.84 (d, J = 1.6Hz, 1H). mp 226.0–232.0°C	133.4
化合物 411		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 1.62–1.92 (m, 6H), 2.80 (m, 2H), 3.28 (m, 2H), 4.33 (d, J = 5.0Hz, 2H), 5.28 (s, 2H), 6.66 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.10 (m, 2H), 7.68 (d, J = 8.0Hz, 1H), 7.72 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.75 (m, 2H), 8.16 (m, 1H), 8.79 (d, J = 1.6Hz, 1H). mp 244.0–250.0°C (dec.)	52.2
化合物 412		mp 151.5–154.0 °C	>1000
化合物 413		mp 100.0–101.0 °C	>300.0

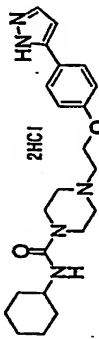
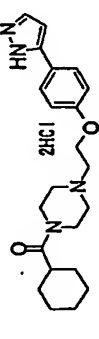
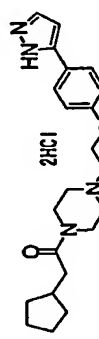
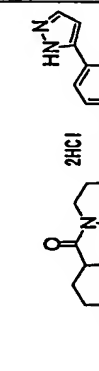
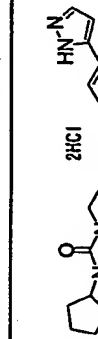
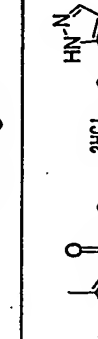
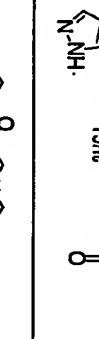
化合物 414		mp 71.5-72.5 °C		43.5
化合物 415		mp 130.0-138.5 °C		>316.0
化合物 416		mp 202.0-203.0 °C		16.3
化合物 417		mp 171.0-175.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 418		DMSO-d ₆ , δ 2.81 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 2.96-3.43 (m, 3H), 3.54-3.74 (m, 5H), 3.76-3.91 (m, 1H), 4.23-4.57 (m, 5H), 6.65 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.70 (d, J = 2.0Hz, 1H), 7.77 (d, J = 8.9Hz, 2H).		86.4
化合物 419		mp 232.5-234.0 °C		>300.0

化合物 420		mp 238.0–240.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 421		DMSO- <i>d</i> ₆ , δ 1.20 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 1.66–1.95 (m, 4H), 2.88–3.19 (m, 4H), 3.22–3.52 (m, 6H), 3.97–4.15 (m, 4H), 6.66 (d, $J = 2.2\text{Hz}$, 1H), 6.99 (d, $J = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.71–7.77 (m, 3H).		>300.0
化合物 422		mp 158.0–164.0 °C		>300.0
化合物 423		mp 198.0–200.0 °C		>300.0
化合物 424		mp 202.0–206.0 °C		11.0
化合物 425		mp 188.0–194.0 °C		106.0

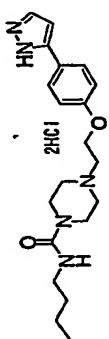
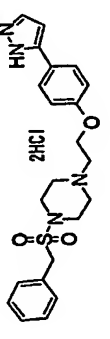
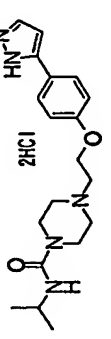
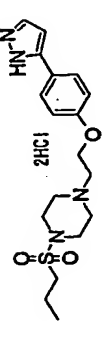
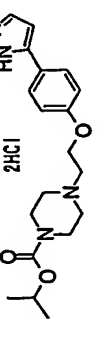
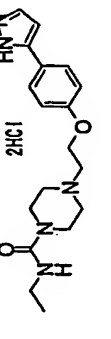
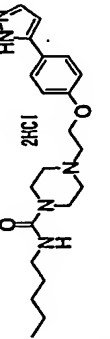
化合物 426		mp 196.0–198.0 °C (dec.)		72.5
化合物 427		mp 153.0–165.0 °C		>300.0
化合物 428		mp 188.5–190.5 °C		13.0
化合物 429		mp 181.0–184.0 °C		21.8
化合物 430		mp 198.5–200.0 °C		23.3
化合物 431		mp 186.0–189.0 °C		>300.0

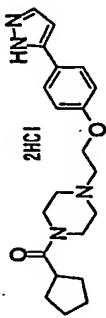
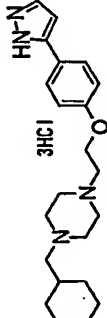
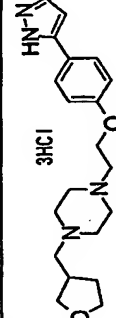
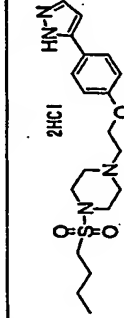
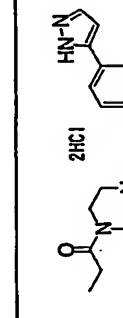
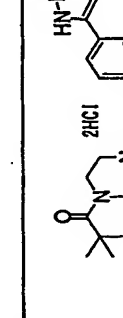
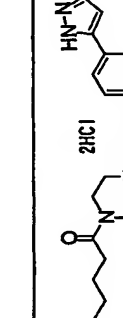
化合物 432		mp 125.0–127.5 °C		8.1
化合物 433		mp 162.5–165.0 °C		108.9
化合物 434		DMSO-d ₆ , δ 1.22 (t, J = 7.2 Hz, 6H), 2.72 (m, 1H), 2.80–3.33 (m, 12H), 3.50–3.74 (m, 5H), 4.10 (m, 1H), 4.38–4.56 (m, 3H), 6.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 10.45 (br, 1H), 11.73 (br, 1H).		>300.0
化合物 435		mp 233.5–235.0 °C		46.1
化合物 436		mp 215.0–216.0 °C		19.6
化合物 437		mp 150.5–153.5 °C		111.2
化合物 438		DMSO-d ₆ , δ 1.66–1.87 (m, 6H), 2.77–3.04 (m, 4H), 3.09–3.30 (m, 4H), 3.34–3.52 (m, 4H), 3.54–4.04 (m, 6H), 4.39–4.56 (m, 2H), 6.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.73 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 10.41 (br, 1H).		>300.0






化合物 439		mp 218.5-222.5 °C (dec.)		171.5
化合物 440		DMSO-d ₆ , δ 0.07-0.15 (m, 2H), 0.41-0.51 (m, 2H), 0.96 (m, 1H), 2.27-2.37 (m, 2H), 2.97-3.25 (m, 2H), 3.40-3.80 (m, 7H), 4.03 (m, 1H), 4.40-4.55 (m, 3H) 6.73 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.77-7.86 (m, 3H), 9.91 (br, 1H) 11.61 (br, 1H).		29.0
化合物 441		DMSO-d ₆ , δ 1.94-2.11 (m, 2H), 2.97-3.26 (m, 3H), 3.39 (m, 1H), 3.48-3.80 (m, 8H), 3.87 (m, 1H), 4.18 (m, 1H), 4.39-4.54 (m, 3H), 6.69 (d, J = 1.9Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.75 (d, J = 2.2Hz, 1H), 7.79 (d, J = 8.9Hz, 2H) 11.47 (br, 1H).		250.8
化合物 442		mp 204.0-209.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 443		mp 194.0-200.0 °C (dec.)		46.7
化合物 444		DMSO-d ₆ , δ 0.90 (s, 3H), 0.92 (s, 3H), 1.98 (m, 1H), 2.22-2.27 (m, 2H), 2.97-3.25 (m, 2H), 3.48-3.69 (m, 6H), 4.09 (m, 1H), 4.40-4.56 (m, 3H), 6.72 (d, J = 2.3Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9Hz, 2H), 7.77-7.84 (m, 3H), 11.67 (br, 1H).		40.2
化合物 445		mp 217.0-218.5 °C (dec.)		60.1

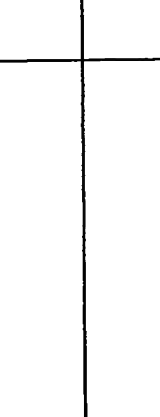
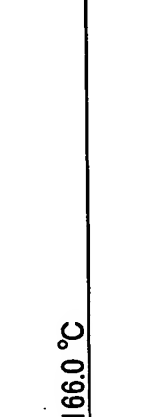
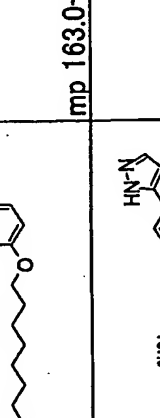
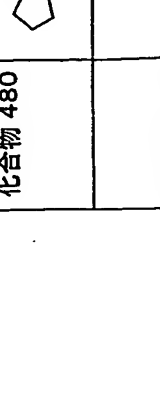
化合物 446	 <chem>C1CCCCC1C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 225.0–229.0 °C (dec.)		35.0
化合物 447	 <chem>C1CCCCC1C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 240.0–242.0 °C		>300.0
化合物 448	 <chem>C1CCCC1C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 200.0–210.0 °C		>300.0
化合物 449	 <chem>COc1ccc(cc1)C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 204.0–210.0 °C		>300.0
化合物 450	 <chem>C1CCCC1C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 215.0–217.0 °C		230.4
化合物 451	 <chem>CC(=O)C1=CC=C(C=C1)C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 205.0–215.0 °C		213.9
化合物 452	 <chem>C1CC1C(=O)N2CCN(CC2)COc3ccc(cc3)C4=CN=CN4.Cl</chem>	mp 169.0–172.0 °C		169.1

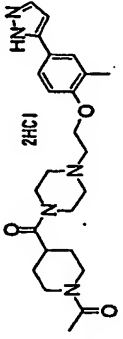
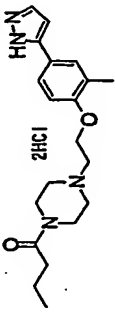
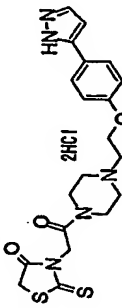
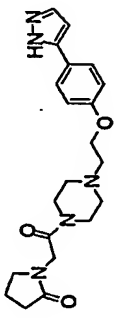
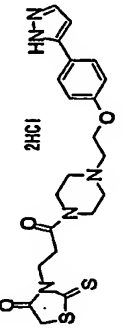
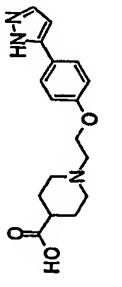
化合物 453		mp 172.0–178.0 °C	106.0
化合物 454		mp 215.0–220.0 °C	160.8
化合物 455		mp 152.0–157.0 °C	111.2
化合物 456		mp 121.0–125.0 °C	149.9
化合物 457		mp 159.0–165.0 °C	>300.0
化合物 458		(500 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆), δ 1.31 & 1.38 (each s, 9H), 1.70–1.86 (m, 3H), 2.18 (m, 1H), 2.70–4.00 (m, 11H), 4.22–4.76 (m, 4H), 6.58 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 1H), 7.03 (brd, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H), 7.63 (br, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H).	>300.0
化合物 459		mp 203.5–204.5 °C	102.0

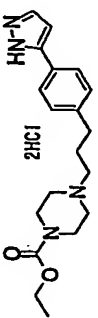
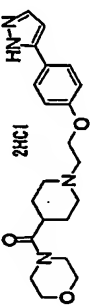
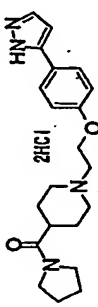
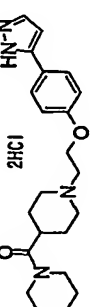
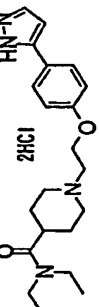
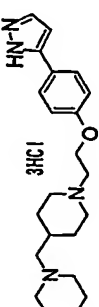
化合物 460		mp 202.0–204.5 °C		49.9
化合物 461		mp 163.0–167.0 °C		200.2
化合物 462		mp 185.0–187.0 °C		>300.0
化合物 463		mp 209.0–210.5 °C		>300.0
化合物 464		mp 206.0–208.0 °C		231.3
化合物 465		mp 138.0–144.0 °C		>300.0
化合物 466		mp 170.0–172.0 °C (dec.)		49.4

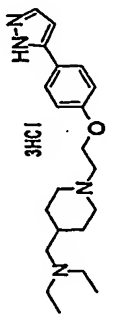
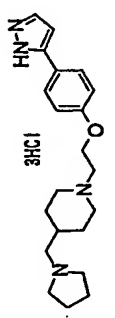
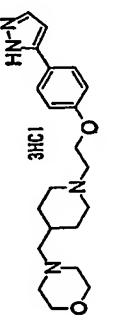
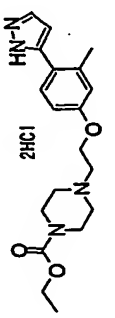
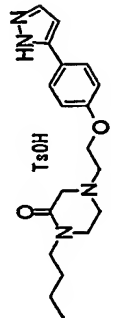
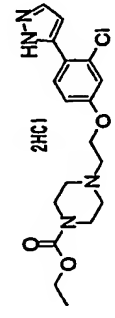
化合物 467		mp 195.0–199.0 °C (dec.)		>1,000
化合物 468		mp 272.0–273.0 °C (dec.)		32.8
化合物 469		mp 223.0–227.0 °C (dec.)		211.0
化合物 470		mp 180.0–184.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 471		mp 195.0–197.0 °C (dec.)		>300.0
化合物 472		mp 236.0–238.5 °C (dec.)		>300.0
化合物 473		mp 154.0–158.0 °C		>300.0

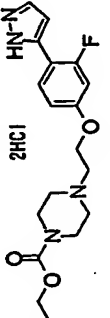
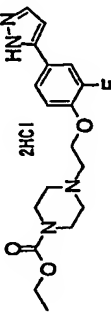
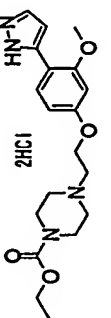
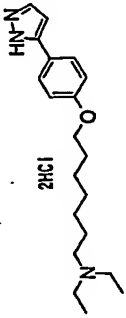
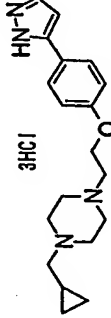
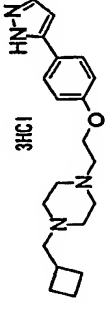
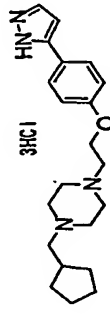
化合物 474		mp 172.0-177.0 °C		>1000
化合物 475		mp 191.0-198.0 °C		655.1
化合物 476		mp 122.0-126.0 °C		435.4
化合物 477		mp 192.0-196.0 °C		>1000
化合物 478		mp 196.0-198.0 °C		>1000
化合物 479		mp 192.0-195.0 °C		>1000

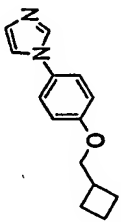
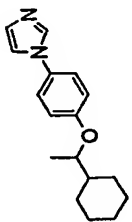
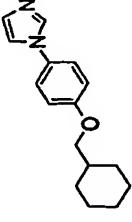
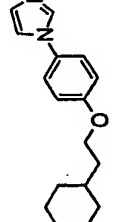
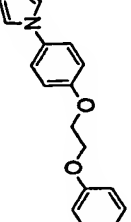
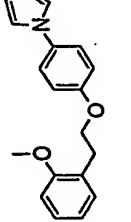
化合物 480		mp 163.0-166.0 °C			>1000
化合物 481		mp 191.0-193.5 °C			>1000
化合物 482		mp 125.0-128.0 °C			597.1
化合物 483		mp 161.0-163.0 °C			>1000
化合物 484		mp 105.0-113.0 °C			361.7
化合物 485		mp 154.0-158.0 °C			>1000

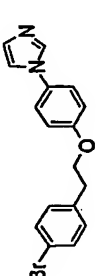
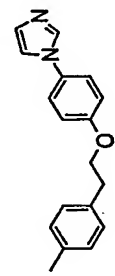
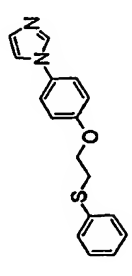
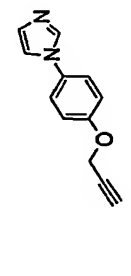
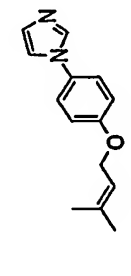
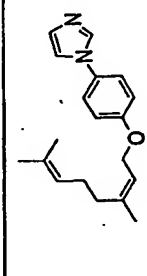
化合物 486		DMSO-d ₆ , δ 1.20-1.58 (m, 2H), 1.61-1.82 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.61 (m, 1H), 2.85-3.31 (m, 6H), 3.48-3.74 (m, 5H), 3.81 (m, 1H) 4.16-4.55 (m, 4H), 6.73 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 7.04 (d, $J = 9.0\text{Hz}$, 1H), 7.67 (d, $J = 9.5\text{Hz}$, 2H), 7.81 (d, $J = 2.2\text{Hz}$, 1H).	>1000
化合物 487		mp 144.0-147.0 °C	>1000
化合物 488		mp 181.0-186.0 °C	68.3
化合物 489		mp 164.0-166.5 °C	248.4
化合物 490		mp 135.0-140.0 °C	131.1
化合物 491		mp 188.5-192.0 °C	>1000

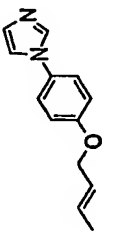
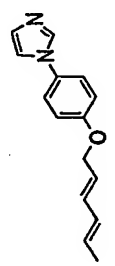
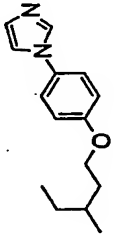
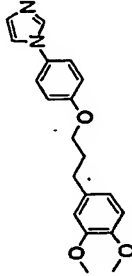
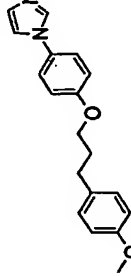
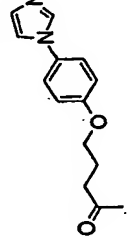
化合物 492	 <chem>CCOC(=O)N1CCN(CC1)CN(C2=CC=C(C=C2)C3=CC=CC=N3)Cl</chem>	mp 175.0–177.5 °C		502.8
化合物 493	 <chem>C1CCN(CC1)C(=O)N2CCOCC2CN(C3=CC=C(C=C3)C4=CC=CC=N4)Cl</chem>	mp 224.0–226.0 °C		>1000
化合物 494	 <chem>C1CCN(CC1)C(=O)N2CCCC2CN(C3=CC=C(C=C3)C4=CC=CC=N4)Cl</chem>	mp 159.0–161.5 °C		>1000
化合物 495	 <chem>C1CCN(CC1)C(=O)N2CCCCC2CN(C3=CC=C(C=C3)C4=CC=CC=N4)Cl</chem>	mp 205.5–208.0 °C		>1000
化合物 496	 <chem>CCN(C1CCN(CC1)C(=O)N2CCCC2)CN(C3=CC=C(C=C3)C4=CC=CC=N4)Cl</chem>	mp 127.0–130.0 °C		>1000
化合物 497	 <chem>C1CCN(CC1)C(=O)N2CCOCC2CN(C3=CC=C(C=C3)C4=CC=CC=N4)Cl</chem>	mp 212.0–215.0 °C		>1000

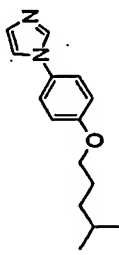
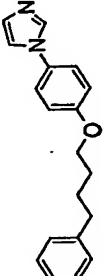
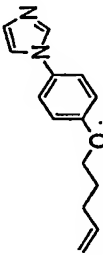
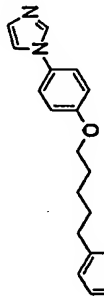
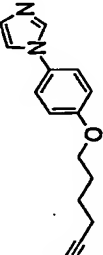
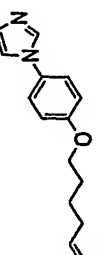
化合物 498	 3HCl	mp 148.0–150.5 °C	>1000
化合物 499	 3HCl	mp 272.0–275.0 °C	>1000
化合物 500	 3HCl	mp 242.5–243.0 °C	>1000
化合物 501	 2HCl	mp 196.5–199.0 °C	372.5
化合物 502	 TsOH	mp 147.0–150.0 °C	>1000
化合物 503	 2HCl	mp 193.0–195.0 °C	>1,000

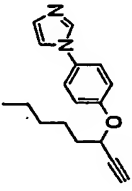
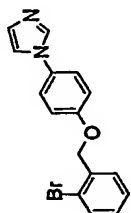
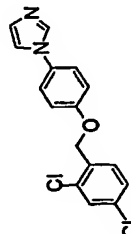
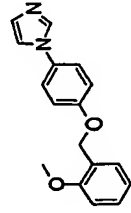
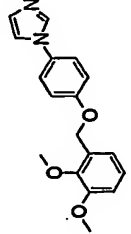
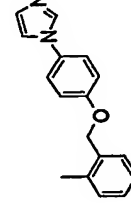
化合物 504		mp 199.5-201.0 °C		>1,000
化合物 505		mp 207.0-208.5 °C		>1,000
化合物 506		mp 185.0-186.0 °C		>1,000
化合物 507		mp 78.0-81.0 °C		>1,000
化合物 508		mp 194.0-196.0 °C		>1,000
化合物 509		mp 206.0-210.0 °C		>1,000
化合物 510		mp 227.0-230.0 °C (dec.)		>1,000

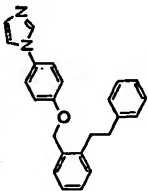
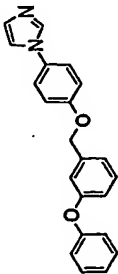
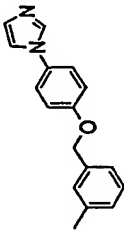
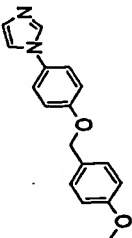
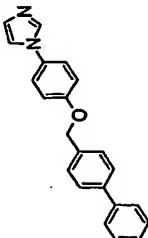
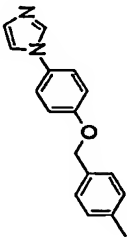
化合物 511		δ 1.86–2.04 (m, 4H), 2.15 (m, 2H), 2.79 (m, 1H), 3.96 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	85.8
化合物 512		δ 1.03–1.22 (m, 4H), 1.27 (d, $J = 6.1\text{Hz}$, 3H), 1.58–1.80 (m, 6H), 1.93 (m, 1H), 4.15 (d, $J = 6.1\text{Hz}$, 1H), 6.95 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	79.6
化合物 513		δ 1.04–1.19 (m, 2H), 1.20–1.39 (m, 3H), 1.62–1.92 (m, 6H), 3.78 (d, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	84.4
化合物 514		δ 1.00 (m, 2H), 1.19–1.38 (m, 3H), 1.45–1.80 (m, 8H), 4.03 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	94.1
化合物 515		δ 4.37 (s, 4H), 6.95–6.98 (m, 3H), 7.05 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.26–7.33 (m, 3H), 7.77 (s, 1H).	96.9
化合物 516		δ 3.14 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.19 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 6.88–6.95 (m, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18–7.13 (m, 6H), 7.76 (s, 1H).	97.3

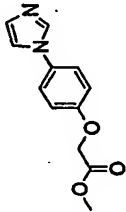
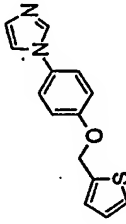
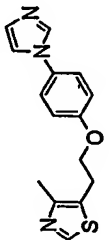
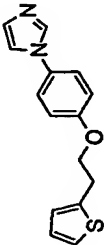
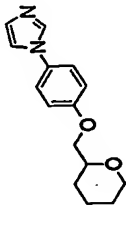
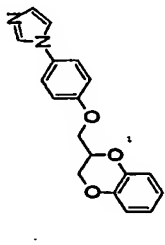
化合物 517		<i>d</i> 3.07 (t, <i>J</i> = 6.7Hz, 2H), 4.18 (t, <i>J</i> = 6.7Hz, 2H), 6.96 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.16–7.20 (m, 4H), 7.29 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.45 (m, <i>J</i> _{AB} = 8.2Hz, 2H), 7.75 (s, 1H).	100.8	
化合物 518		<i>d</i> 2.34 (s, 3H), 3.09 (t, <i>J</i> = 7.1Hz, 2H), 4.18 (t, <i>J</i> = 7.1Hz, 2H), 6.97 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.13–7.20 (m, 4H), 7.27 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.75 (s, 1H).	105.9	
化合物 519		<i>d</i> 3.32 (t, <i>J</i> = 6.9Hz, 2H), 4.18 (t, <i>J</i> = 6.9Hz, 2H), 6.93 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.21–7.35 (m, 5H), 7.43 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.75 (s, 1H).	99.0	
化合物 520		<i>d</i> 2.56 (t, <i>J</i> = 2.5Hz, 1H), 4.75 (d, <i>J</i> = 2.5Hz, 2H), 7.08 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.10 (s, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.33 (m, <i>J</i> _{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.77 (s, 1H).	42.9	
化合物 521		<i>d</i> 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 4.55 (d, <i>J</i> = 6.7Hz, 2H), 5.50 (m, 1H), 6.99 (m, <i>J</i> _{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.29 (m, <i>J</i> _{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	93.8	
化合物 522		<i>d</i> 1.62 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.15 (m, 4H), 4.54 (d, <i>J</i> = 6.8Hz, 2H), 5.12 (m, 1H), 5.51 (t, <i>J</i> = 6.8Hz, 1H), 6.99 (m, <i>J</i> _{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.29 (m, <i>J</i> _{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	91.9	

化合物 523		δ 1.78 (dd, $J = 1.4, 6.2\text{Hz}$, 3H), 4.50 (dt, $J = 1.2, 5.9\text{Hz}$, 2H), 5.69–5.96 (m, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	104.9
化合物 524		δ 1.78 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 3H), 4.58 (d, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 5.73–5.81 (m, 2H), 6.10 (m, 1H), 6.35 (dd, $J = 10.7, 15.7\text{Hz}$, 3H), 6.99 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	98.1
化合物 525		δ 0.92 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 0.96 (d, $J = 6.4\text{Hz}$, 3H), 1.26 (m, 1H), 1.40 (m, 1H), 1.62 (m, 2H), 1.84 (m, 1H), 4.02 (m, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	104.0
化合物 526		δ 2.11 (tt, $J = 6.2, 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.78 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 3.99 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.74–6.82 (m, 3H), 6.85 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	97.4
化合物 527		δ 2.10 (tt, $J = 6.4, 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.77 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.98 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 6.85 (m, $J_{AB} = 8.5\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.13 (m, $J_{AB} = 8.5\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	99.5
化合物 528		δ 2.09 (tt, $J = 6.1, 7.2\text{Hz}$, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.68 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 4.02 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	105.4

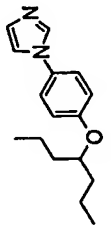
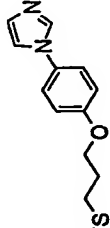
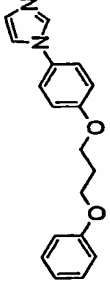
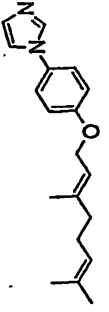
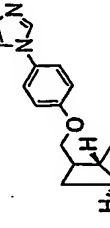
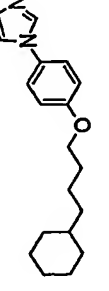
化合物 529		δ 0.94 (d, $J = 6.5\text{Hz}$, 6H), 1.37 (m, 2H), 1.63 (m, 2H), 1.81 (m, 2H), 3.98 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	85.7	
化合物 530		δ 1.80-1.90 (m, 4H), 2.71 (t, $J = 7.1\text{Hz}$, 2H), 4.00 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 6.95 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18-7.32 (m, 9H), 7.76 (s, 1H).	94.0	
化合物 531		δ 1.91 (m, 2H), 2.25 (m, 2H), 4.01 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 5.01-5.12 (m, 2H), 5.85 (m, 1H), 6.98 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	99.2	
化合物 532		δ 1.47-1.89 (m, 6H), 2.66 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.98 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18-7.20 (m, 5H), 7.26-7.31 (m, 4H), 7.76 (s, 1H).	88.5	
化合物 533		δ 1.74 (m, 2H), 1.92 (m, 2H), 1.98 (t, $J = 2.6\text{Hz}$, 2H), 2.30 (dt, $J = 2.6$, 7.0Hz, 2H), 4.03 (t, $J = 6.3\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	99.5	
化合物 534		δ 1.60 (m, 2H), 1.83 (quint, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 2.14 (q, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.00 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 4.98-5.08 (m, 2H), 5.77-5.91 (m, 1H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	99.1	

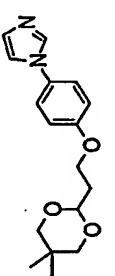
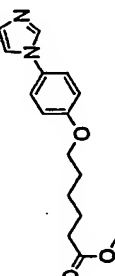
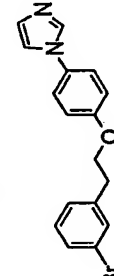
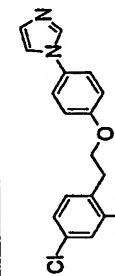
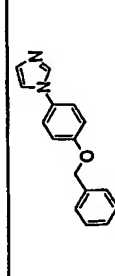
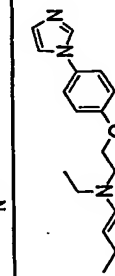
化合物 541		δ 0.92 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 3H), 1.26–1.39 (m, 4H), 1.59 (m, 2H), 1.97 (m, 2H), 4.74 (m, 1H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.31 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.77 (s, 1H).	87.1	
化合物 542		δ 5.18 (s, 2H), 7.07 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.32 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.74 (d, $J = 7.6\text{Hz}$, 1H), 7.60 (d, $J = 7.9\text{Hz}$, 1H), 7.77 (s, 1H).	108.3	
化合物 543		δ 5.17 (s, 2H), 7.05 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.26–7.35 (m, 3H), 7.45–7.52 (m, 2H), 7.77 (s, 1H).	106.6	
化合物 544		δ 3.88 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 6.93 (d, $J = 8.4\text{Hz}$, 1H), 6.99 (d, $J = 7.3\text{Hz}$, 1H), 7.07 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.26–7.35 (m, 3H), 7.44 (d, $J = 7.3\text{Hz}$, 1H), 7.76 (s, 1H).	108.9	
化合物 545		δ 3.90 (s, 6H), 5.16 (s, 2H), 6.93 (dd, $J = 2.3, 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.04–7.13 (m, 4H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.30 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	97.2	
化合物 546		δ 2.40 (s, 3H), 5.08 (s, 2H), 7.07 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.23–7.33 (m, 5H), 7.41 (d, $J = 7.3\text{Hz}$, 1H), 7.77 (s, 1H).	100.5	

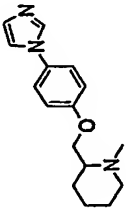
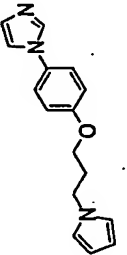
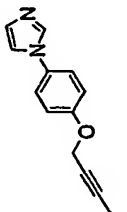
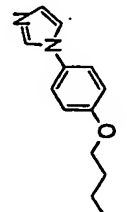
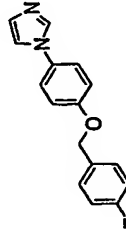
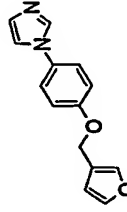
化合物 547		<i>d</i> 2.92-3.03 (m, 4H), 4.98 (s, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.12-7.36 (m, 10H), 7.41 (d, $J = 7.8\text{Hz}$, 1H), 7.77 (s, 1H).	83.5	
化合物 548		<i>d</i> 5.08 (s, 2H), 6.96-7.05 (m, 5H), 7.10-7.20 (m, 5H), 7.26-7.39 (m, 5H), 7.76 (s, 1H).	90.2	
化合物 549		<i>d</i> 2.39 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 7.05 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.15-7.32 (m, 8H), 7.76 (s, 1H).	110.6	
化合物 550		<i>d</i> 3.83 (s, 3H), 5.03 (s, 2H), 6.93 (m, $J_{AB} = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.04 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.37 (m, $J_{AB} = 8.7\text{Hz}$, 1H), 7.76 (s, 1H).	101.9	
化合物 551		<i>d</i> 5.16 (s, 2H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.31 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.32-7.65 (m, 9H), 7.77 (s, 1H).	67.0	
化合物 552		<i>d</i> 2.37 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 7.04 (m, $J_{AB} = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.19-7.23 (m, 4H), 7.26-7.35 (m, 4H), 7.76 (s, 1H).	97.3	

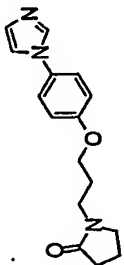
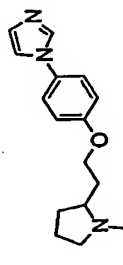
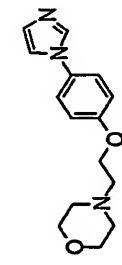
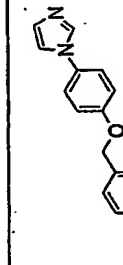
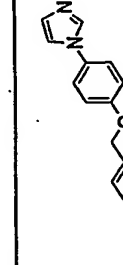
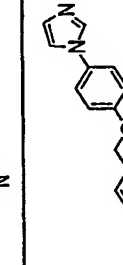
化合物 553		d 3.83 (s, 3H), 4.69 (s, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.32 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.78 (s, 1H).	61.3	
化合物 554		d 5.27 (s, 2H), 7.02 (m, 1H), 7.07 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.14 (d, $J = 3.4\text{Hz}$, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.31 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.35 (m, 1H), 7.77 (s, 1H).	99.7	
化合物 555		d 2.47 (s, 3H), 3.28 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 4.18 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.30 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H), 8.61 (s, 1H).	96.0	
化合物 556		d 3.34 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 4.23 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 5.95 (m, 1H), 7.00 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	100.4	
化合物 557		d 1.45-1.76 (m, 6H), 3.53 (m, 1H), 3.74 (m, 1H), 3.92 (dd, $J = 3.9$, 10.0Hz, 1H), 4.00 (dd, $J = 6.4$, 10.0Hz, 1H), 4.08 (m, 1H), 7.01 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	10.9	
化合物 558		d 4.17-4.30 (m, 3H), 4.42 (dd, $J = 2.5$, 11.4Hz, 1H), 4.59 (m, 1H), 6.86-6.95 (m, 4H), 7.03 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.77 (s, 1H).	15.1	

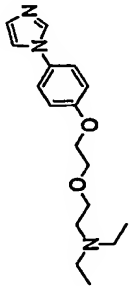
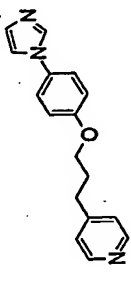
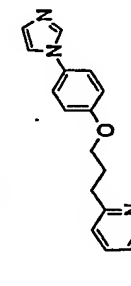
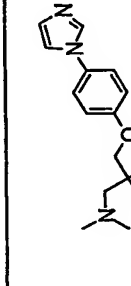
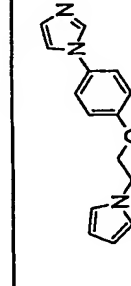
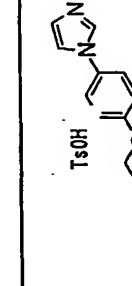
化合物 559		δ 2.50 (s, 3H), 5.06 (s, 2H), 7.04 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.26–7.38 (m, 6H), 7.76 (s, 1H).	95.0	
化合物 560		δ 3.16 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.21 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.05 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.26–7.32 (m, 3H), 7.76 (s, 1H).	106.7	
化合物 561		δ 5.15 (s, 2H), 6.89–7.11 (m, 4H), 7.19 (m, 3H), 7.30–7.49 (m, 2H), 7.77 (s, 1H).	102.8	
化合物 562		δ 2.05 (m, 2H), 2.41 (t, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 3.60 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 3.71 (t, $J = 5.2\text{Hz}$, 2H), 4.15 (t, $J = 5.2\text{Hz}$, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.21 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.30 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	95.7	
化合物 563		δ 5.12 (s, 2H), 7.04 (m, 8.8Hz, 2H), 7.16–7.21 (m, 3H), 7.26–7.39 (m, 4H), 7.77 (s, 1H).	106.6	
化合物 564		δ 2.75 (d, $J = 2.0\text{Hz}$, 1H), 5.86 (d, $J = 2.0\text{Hz}$, 1H), 7.17–7.71 (m, 11H), 7.78 (s, 1H).	92.9	

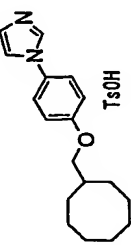
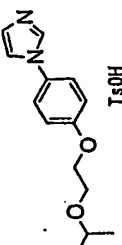
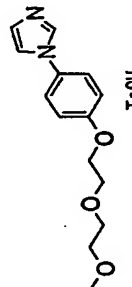
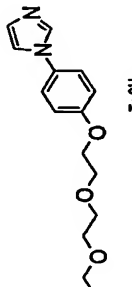
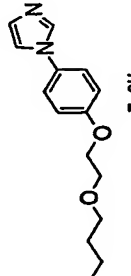
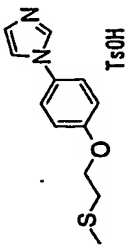
化合物 565		δ 0.94 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 1.26–1.54 (m, 4H), 1.57–1.73 (m, 4H), 4.27 (quint, $J = 5.9\text{Hz}$, 1H), 6.96 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.26 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	84.7
化合物 566		δ 2.09–2.15 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.71 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.11 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.30 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	95.0
化合物 567		δ 2.29 (quint, $J = 6.0\text{Hz}$, 2H), 4.18 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 4.21 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 6.91–7.02 (m, 5H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.26–7.33 (m, 4H), 7.76 (s, 1H).	98.0
化合物 568		δ 1.61 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.08–2.17 (m, 4H), 4.58 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 5.09 (m, 1H), 5.49 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 1H), 6.99 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.77 (s, 1H).	100.7
化合物 569		δ 1.13–1.82 (m, 9H), 2.26–2.62 (m, 2H), 3.85–4.00 & 3.28–3.69 (m, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	96.1
化合物 570		δ 0.87–0.94 (m, 2H), 1.08–1.33 (m, 6H), 1.43–1.53 (m, 2H), 1.63–1.83 (m, 7H), 3.98 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	58.8

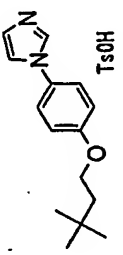
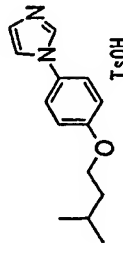
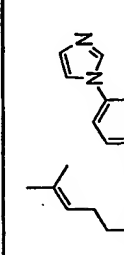
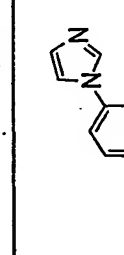

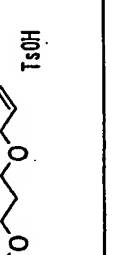
化合物 571		δ 0.74 (s, 3H), 1.21 (s, 3H), 2.15 (dt, $J = 5.1$, 6.5Hz, 2H), 3.46 (d, $J = 11.0$ Hz, 2H), 3.63 (d, $J = 11.0$ Hz, 2H), 4.14 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 4.70 (t, $J = 5.1$ Hz, 1H), 6.99 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	91.8	
化合物 572		δ 1.26 (t, $J = 7.1$ Hz, 3H), 1.45–1.58 (m, 2H), 1.65–1.75 (m, 2H), 1.77–1.88 (m, 2H), 2.35 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 3.99 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 4.14 (q, $J = 7.1$ Hz, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	98.0	
化合物 573		δ 3.09 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 4.20 (t, $J = 6.8$ Hz, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.17–7.32 (m, 5H), 7.39 (ddd, $J = 1.7$, 2.1, 7.1Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 7.76 (s, 1H).	92.9	
化合物 574		δ 3.23 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 4.21 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.23–7.30 (m, 4H), 7.41 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.76 (s, 1H).	83.2	
化合物 575		δ 5.14 (s, 2H), 7.05 (m, $J_{AB} = 8.9$ Hz, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.33 (m, $J_{AB} = 8.9$ Hz, 2H), 7.50–7.56 (m, 1H), 7.64–7.70 (m, 2H), 7.77 (s, 1H).	76.9	
化合物 576		δ 1.21 (t, $J = 7.2$ Hz, 3H), 2.32 (s, 3H), 3.48 (q, $J = 7.2$ Hz, 2H), 3.74 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.15 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 6.53–6.67 (m, 3H), 6.97 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.10–7.16 (m, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.80 (s, 1H).	85.1	

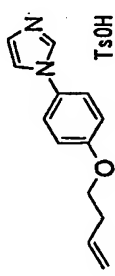
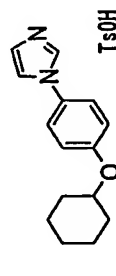
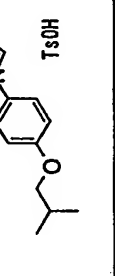
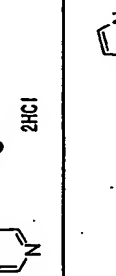
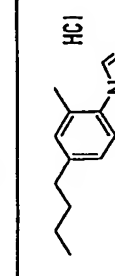

化合物 577		δ 1.63–1.82 (m, 6H), 2.40 & 2.43 (m, 3H), 2.60–2.91 (m, 3H), 4.05 & 4.52 (m, 1H), 6.96 (m, 9.0Hz, 2H), 7.19 (d, $J = 5.6$ Hz, 2H), 7.28 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.28 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	40.2	
化合物 578		δ 2.24 (tt, $J = 5.9, 6.7$ Hz, 2H), 3.91 (t, $J = 5.9$ Hz, 2H), 4.14 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 6.15 (dd, $J = 2.0, 2.2$ Hz, 2H), 6.66 (dd, $J = 2.0, 2.2$ Hz, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 8.9$ Hz, 2H), 7.20 (s, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.30 (m, $J_{AB} = 8.9$ Hz, 2H), 7.78 (s, 1H).	110.5	
化合物 579		δ 1.88 (t, $J = 2.2$ Hz, 3H), 4.70 (q, $J = 2.2$ Hz, 2H), 7.06 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.32 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.78 (s, 1H). mp 81.0–83.5 °C	80.6	7.2
化合物 580		δ 0.99 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.49 (sext, $J = 7.3$ Hz, 2H), 1.73–1.87 (m, 2H), 4.00 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.76 (s, 1H). mp 47.0–50.0 °C	98.3	6.4
化合物 581		δ 5.07 (s, 2H), 7.03–7.46 (m, 10H), 7.77 (s, 1H). mp 91.5–93.0 °C	109.0	1.3
化合物 582		δ 4.99 (s, 2H), 6.51 (d, $J = 1.1$ Hz, 1H), 7.01–7.09 (m, 2H), 7.19–7.36 (m, 4H), 7.46 (t, $J = 1.7$ Hz, 1H), 7.54 (dd, $J = 0.9, 1.7$ Hz, 1H), 7.78 (t, $J = 1.1$ Hz, 1H). mp 114.5–115.5 °C	99.3	4.7

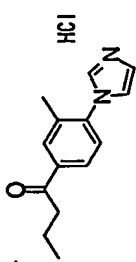
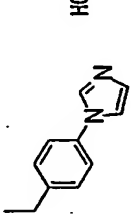
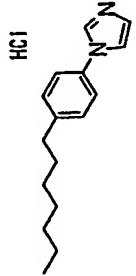
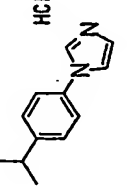
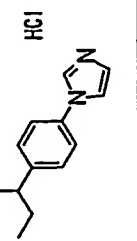
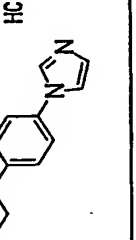
化合物 583		δ 2.01–2.13 (m, 4H), 2.40 (t, J = 8.4Hz, 2H), 3.38–3.54 (m, 4H), 4.03 (t, J = 6.2Hz, 2H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	72.4	7.3
化合物 584		δ 2.58–2.67 (m, 4H), 2.84 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.71–3.78 (m, 4H), 4.15 (t, J = 5.7Hz, 2H), 6.97 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.76 (s, 1H).	55.2	33.5
化合物 585		δ 2.60 (m, 4H), 2.83 (t, J = 5.6Hz, 2H), 3.75 (m, 4H), 4.15 (t, J = 5.8Hz, 2H), 7.00 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.30 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.76 (s, 1H). mp 41.0–43.5 °C	66.7	8.6
化合物 586		(200 MHz, DMSO- d_6) δ 5.24 (s, 2H), 7.08 (t, J = 1.1Hz, 2H), 7.10–7.21 (m, 2H), 7.37 (m, 1H), 7.50–7.63 (m, 3H), 7.65 (t, J = 1.3Hz, 1H), 7.78 (dt, J = 1.8, 7.7Hz, 1H), 8.14 (t, J = 1.1Hz, 1H), 8.60 (m, 1H). mp 94.0–95.0 °C	70.8	4.5
化合物 587		δ 5.14 (s, 2H), 7.07 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.27–7.79 (m, 3H), 7.78–7.83 (m, 2H), 8.63 (dd, J = 1.8, 4.8Hz, 1H), 8.72 (d, J = 2.2Hz, 1H). mp 117.5–119.0 °C	93.7	0.63
化合物 588		(200 MHz, DMSO- d_6) δ 5.26 (s, 2H), 7.09–7.23 (m, 3H), 7.43–7.70 (m, 5H), 8.20 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 1.8, 4.6Hz, 2H). mp 104.0–106.0 °C	95.1	4.9

化合物 589		δ 1.05 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.62 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.73 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 3.67 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 3.84 (m, 2H), 4.16 (m, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H).	34.8	62.6
化合物 590		δ 2.16 (ddt, $J = 6.2, 7.3, 8.1\text{Hz}$, 2H), 2.85 (dd, $J = 7.3, 8.1\text{Hz}$, 2H), 4.00 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.15-7.22 (m, 4H), 7.30 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.77 (s, 1H), 8.51-8.54 (m, 2H). mp 70.0-72.0 °C	94.7	1.1
化合物 591		δ 2.28 (ddt, $J = 6.2, 7.0, 8.1\text{Hz}$, 2H), 3.01 (dd, $J = 7.0, 8.1\text{Hz}$, 2H), 4.05 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.97 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.11-7.21 (m, 4H), 7.30 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.61 (dt, $J = 1.8, 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.76 (s, 1H), 8.56 (d, $J = 4.0\text{Hz}$, 1H). mp 64.0-66.0 °C	79.0	2.1
化合物 592		δ 1.01 (s, 6H), 2.29 (s, 6H), 2.30 (s, 2H), 3.74 (s, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.29 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.76 (s, 1H). mp 64.0-66.0 °C	55.8	106.3
化合物 593		(200 MHz, DMSO- d_6) δ 4.27 (s, 4H), 6.00 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 6.85 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 7.00-7.13 (m, 3H), 7.49-7.60 (m, 2H), 7.64 (t, $J = 1.3\text{Hz}$, 1H), 8.13 (t, $J = 1.1\text{Hz}$, 1H). mp 128.5-129.0 °C	110.5	0.8
化合物 594		DMSO- d_6 , δ 0.36 (m, 2H), 0.60 (m, 2H), 1.25 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 3.91 (d, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 7.10-7.21 (m, 4H), 7.49 (m, $J_{AB} = 7.9\text{Hz}$, 2H), 7.71 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 7.90 (dd, $J = 1.3, 1.9\text{Hz}$, 1H), 8.22 (dd, $J = 1.5, 1.9\text{Hz}$, 1H), 9.60 (dd, $J = 1.3, 1.5\text{Hz}$, 1H). mp 136.0-138.0 °C	71.8	12.5

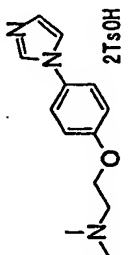
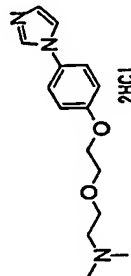
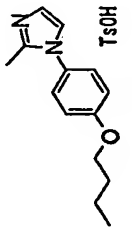
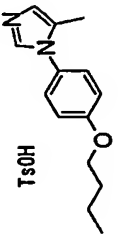
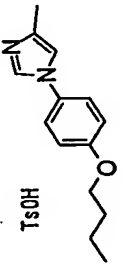
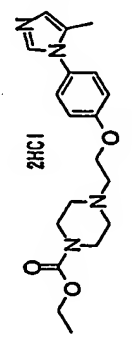
化合物 595		(200 MHz, <i>DMSO-d₆</i>), δ 1.28–2.15 (m, 15H), 2.29 (s, 3H), 3.84 (d, J = 6.6Hz, 2H), 7.08–7.25 (m, 4H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.70 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.89 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 1.3, 1.8Hz, 1H), 9.56 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 232.5–233.0 °C	91.6	2.7
化合物 596		(200 MHz, <i>DMSO-d₆</i>), δ 1.10 (s, 3H), 1.13 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 3.55–3.78 (m, 3H), 4.13–4.20 (m, 2H), 7.11 (m, J_{AB} = 7.9Hz, 2H), 7.20 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.89 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.3, 1.8Hz, 1H), 9.58 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 150.0–153.0 °C	90.0	5.5
化合物 597		<i>DMSO-d₆</i> , δ 2.29 (s, 3H), 3.25 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 3.76 (m, 2H), 4.20 (m, 2H), 7.11 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.19 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.3, 1.9Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 1.5, 1.9Hz, 1H), 9.61 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 113.0–116.0 °C	72.1	32.4
化合物 598		(200 MHz, <i>DMSO-d₆</i>), δ 1.10 (t, J = 7.0Hz, 3H), 2.29 (s, 3H), 3.38–3.65 (m, 6H), 3.74–3.83 (m, 2H), 4.15–4.25 (m, 2H), 7.12 (m, J_{AB} = 7.9Hz, 2H), 7.20 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.3, 1.8Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 9.59 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 117.0–117.5 °C	66.4	18.5
化合物 599		(200 MHz, <i>DMSO-d₆</i>), δ 0.88 (t, J = 7.0Hz, 3H), 1.23–1.60 (m, 4H), 2.29 (s, 3H), 3.46 (t, J = 6.4Hz, 2H), 3.69–3.75 (m, 2H), 4.13–4.23 (m, 2H), 7.11 (m, J_{AB} = 7.9Hz, 2H), 7.20 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.72 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.3, 1.8Hz, 1H), 9.59 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 137.0–139.0 °C	96.7	4.1
化合物 600		<i>DMSO-d₆</i> , δ 2.17 (s, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.88 (t, J = 6.6Hz, 1H), 4.24 (t, J = 6.6Hz, 2H), 7.12 (m, J_{AB} = 8.0Hz, 2H), 7.20 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.0Hz, 2H), 7.73 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.3, 1.9Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 1.5, 1.9Hz, 1H), 9.61 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 140.0–142.0 °C	91.8	7.5

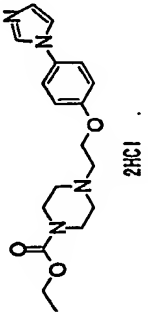
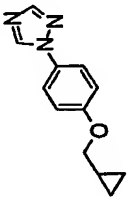
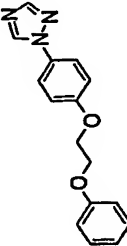
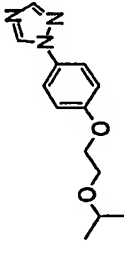
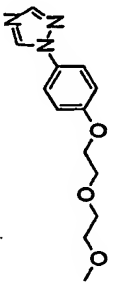
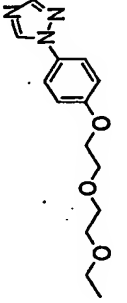
化合物 601		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 0.98 (s, 9H), 1.68 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.11 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 7.9$ Hz, 2H), 7.19 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.48 (m, $J_{AB} = 8.1$ Hz, 2H), 7.71 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.90 (dd, $J = 1.5$, 1.8Hz, 1H), 8.21 (dd, $J = 1.3$, 1.8Hz, 1H), 9.58 (dd, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 220.0–221.0 °C	101.8	1.8
化合物 602		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 0.95 (d, $J = 6.4$ Hz, 6H), 1.64 (q, $J = 6.4$ Hz, 2H), 1.80 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 4.08 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 7.12 (m, $J_{AB} = 7.9$ Hz, 2H), 7.18 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.49 (m, $J_{AB} = 7.9$ Hz, 2H), 7.71 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.90 (dd, $J = 1.3$, 1.9Hz, 1H), 8.21 (dd, $J = 1.5$, 1.9Hz, 1H), 9.59 (dd, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 152.0–153.0 °C	102.8	2.3
化合物 603		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 0.93 (d, $J = 6.2$ Hz, 3H), 1.08–2.10 (m, 13H), 2.29 (s, 3H), 4.09 (t, $J = 7.0$ Hz, 2H), 5.10 (m, 1H), 7.08–7.25 (m, 4H), 7.48 (m, $J_{AB} = 8.1$ Hz, 2H), 7.71 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.90 (dd, $J = 1.3$, 2.0Hz, 1H), 8.21 (dd, $J = 1.5$, 2.0Hz, 1H), 9.58 (dd, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 148.0–150.0 °C	100.2	5.3
化合物 604		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 0.99 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.76 (tq, $J = 6.6$, 7.5Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.02 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 7.12 (m, $J_{AB} = 7.9$ Hz, 2H), 7.17 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.49 (m, $J_{AB} = 7.9$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.90 (dd, $J = 1.3$, 1.9Hz, 1H), 8.22 (dd, $J = 1.5$, 1.9Hz, 1H), 9.61 (dd, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 148.0–150.0 °C	82.7	7.7
化合物 605		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 1.11 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 1.90–2.05 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 3.44 (q, $J = 7.0$ Hz, 2H), 3.52 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.11 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 8.3$ Hz, 2H), 7.19 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 7.48 (m, $J_{AB} = 8.1$ Hz, 2H), 7.71 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.89 (dd, $J = 1.5$, 1.8Hz, 1H), 8.21 (dd, $J = 1.3$, 1.8Hz, 1H), 9.56 (dd, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 122.5–124.0 °C	94.3	2.0
化合物 606		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 1.77 (t, $J = 2.6$ Hz, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.58–2.66 (m, 2H), 4.12 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 7.11 (d, $J = 7.7$ Hz, 2H), 7.20 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.48 (m, $J_{AB} = 8.1$ Hz, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.89 (t, $J = 1.5$, 1.8Hz, 1H), 8.22 (t, $J = 1.3$, 1.8Hz, 1H), 9.58 (t, $J = 1.3$, 1.5Hz, 1H). mp 147.5–149.5 °C	95.8	5.0

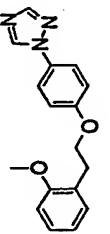
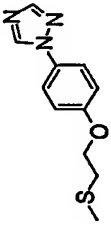
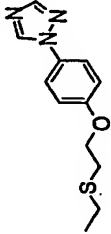
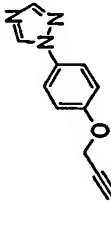
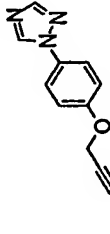
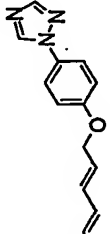
化合物 607		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 2.29 (s, 3H), 2.45–2.58 (m, 2H), 4.12 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 5.05–5.25 (m, 2H), 5.90 (m, 1H), 7.11 (m, J_{AB} = 7.9 Hz, 2H), 7.19 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1 Hz, 2H), 7.71 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.5, 1.8 Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 1.3, 1.8 Hz, 1H), 9.58 (dd, J = 1.3, 1.5 Hz, 1H). mp 133.5–134.5 °C	101.9	2.5
化合物 608		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 1.13–2.05 (m, 10H), 2.29 (s, 3H), 4.47 (m, 1H), 7.11 (m, J_{AB} = 7.7 Hz, 2H), 7.18 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1 Hz, 2H), 7.68 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.89 (dd, J = 1.5, 1.8 Hz, 1H), 8.20 (dd, J = 1.3, 1.8 Hz, 1H), 9.56 (dd, J = 1.3, 1.5 Hz, 1H). mp 187.5–188.0 °C	96.2	3.7
化合物 609		<i>DMSO-d</i> ₆ , δ 0.99 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 2.05 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 3.84 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 7.11 (d, J_{AB} = 8.1 Hz, 2H), 7.18 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1 Hz, 2H), 7.71 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.88 (t, J = 1.5, 1.8 Hz, 1H), 8.20 (t, J = 1.3, 1.8 Hz, 1H), 9.55 (t, J = 1.3, 1.5 Hz, 1H). mp 176.5–178.0 °C	100.6	4.3
化合物 610		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 2.05–2.23 (m, 2H), 2.99 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 4.11 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 7.16 (m, J_{AB} = 9.2 Hz, 2H), 7.74 (m, J_{AB} = 9.2 Hz, 2H), 7.88–8.03 (m, 2H), 8.23 (dd, J = 1.3, 1.8 Hz, 1H), 8.48 (m, 1H), 8.77 (dd, J = 0.9, 5.5 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.69 (dd, J = 1.3, 1.5 Hz, 1H). mp 252.0–253.0 °C	99.1	1.1
化合物 611		(200 MHz, <i>DMSO-d</i> ₆) δ 1.28–1.85 (m, 8H), 2.69 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.91–3.10 (m, 2H), 4.07 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 7.18 (m, J_{AB} = 9.2 Hz, 2H), 7.73 (m, J_{AB} = 9.0 Hz, 2H), 7.89 (dd, J = 1.5, 1.8 Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.3, 1.8 Hz, 1H), 9.65 (dd, J = 1.3, 1.5 Hz, 1H). mp 205.0–207.0 °C	90.0	2.2
化合物 612		δ 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.35–1.42 (m, 2H), 1.58–1.68 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.67 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.21–7.28 (m, 4H), 7.62 (dd, J = 1.4, 1.7 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 1.2, 1.4 Hz, 1H). mp 152.0–153.0 °C		53.4

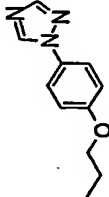
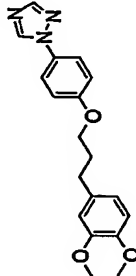
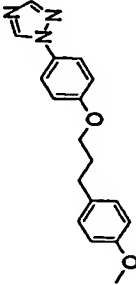
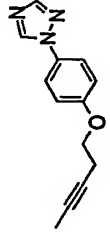
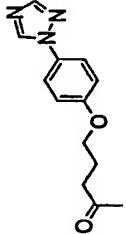
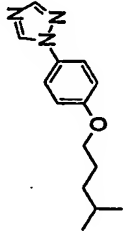
化合物 613		δ 1.03 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.76–1.83 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.98 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 7.29 (dd, $J = 1.3, 1.6$ Hz, 1H), 7.53 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.66 (dd, $J = 1.5, 1.6$ Hz, 1H), 7.97 (dd, $J = 1.9, 8.2$ Hz, 1H), 8.00 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H), 9.35 (dd, $J = 1.3, 1.5$ Hz, 1H). mp 199.5–201.0 °C	462.3
化合物 614		(200 MHz) δ 1.30 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 2.76 (q, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.40–7.50 (m, 5H), 7.58 (d, $J = 1.3$ Hz, 1H), 9.05 (s, 1H).	65.5
化合物 615		(200 MHz) δ 0.89 (t, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.13–1.43 (m, 8H), 1.50–1.75 (m, 2H), 2.70 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 7.35–7.65 (m, 6H), 9.35 (dd, $J = 1.3, 1.5$ Hz, 1H).	3.8
化合物 616		(200 MHz) δ 1.28 (s, 3H), 1.31 (s, 3H), 3.02 (m, 1H), 7.40–7.63 (m, 6H), 9.43 (dd, $J = 1.3, 1.5$ Hz, 1H). mp 205.5–207.5 °C	7.9
化合物 617		(200 MHz) δ 0.85 (t, $J = 7.5$ Hz, 3H), 1.28 (d, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.55–1.75 (m, 2H), 2.63–2.84 (m, 2H), 7.38–7.53 (m, 5H), 7.59 (dd, $J = 1.3, 1.8$ Hz, 1H), 9.13 (dd, $J = 1.3, 1.5$ Hz, 1H). mp 142.0–146.0 °C	17.3
化合物 618		(200 MHz) δ 0.97 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H), 1.58–1.80 (m, 2H), 2.69 (t, $J = 7.3$ Hz, 2H), 7.35–7.55 (m, 5H), 7.59 (dd, $J = 1.3, 1.8$ Hz, 1H), 9.29 (dd, $J = 1.3, 1.5$ Hz, 1H). mp 155.5–157.0 °C	18.8

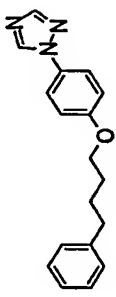
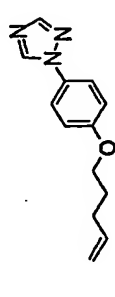
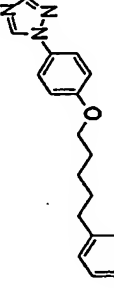



化合物 619		DMSO- d_6 , δ 2.29 (s, 6H), 2.29 (s, 6H), 2.83 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 3.24 (m, 2H), 4.13 (t, J = 6.0Hz, 2H), 7.12 (m, J_{AB} = 8.0Hz, 4H), 7.18 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.0Hz, 4H), 7.74 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.92 (dd, J = 1.3, 1.9Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.5, 1.9Hz, 1H), 9.61 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H).	35.9	50.6
化合物 620		DMSO- d_6 , δ 1.21 (t, J = 7.5Hz, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.64 (q, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 6.6Hz, 2H), 4.23 (t, J = 6.6Hz, 2H), 7.11 (d, J = 7.9Hz, 2H), 7.20 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.49 (d, J = 7.9Hz, 2H), 7.73 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.3, 1.9Hz, 1H), 8.22 (dd, J = 1.5, 1.9Hz, 1H), 9.61 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H).	97.9	1.8
化合物 621		mp 147.0-149.0 °C DMSO- d_6 , δ 1.28 (t, J = 7.3Hz, 6H), 3.10-3.30 (m, 4H), 3.46-3.58 (m, 2H), 4.51 (t, J = 5.0Hz, 2H), 7.25 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.78 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.90 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 1.3, 1.8Hz, 1H), 9.66 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H).	33.0	49.5
化合物 622		DMSO- d_6 , δ 2.73 (s, 3H), 5.52 (s, 2H), 7.32 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.68 (d, J = 7.9Hz, 1H), 7.73-7.83 (m, 3H), 7.92 (dd, J = 1.5, 1.8Hz, 1H), 8.20-8.30 (m, 2H), 9.72 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H).	80.4	17.6
化合物 623		mp 236.0-237.0 °C DMSO- d_6 , δ 1.26 (m, 1H), 1.88 (m, 2H), 2.73 (s, 1H), 2.73-2.87 (m, 2H), 3.26-3.51 (m, 2H), 3.93 (dd, J = 7.3, 9.6Hz, 1H), 4.05 (dd, J = 4.7, 9.6Hz, 1H), 7.19 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.90 (d, J = 1.4Hz, 1H), 8.23 (d, J = 1.4Hz, 1H), 9.65 (d, J = 1.4Hz, 1H).	82.2	6.8
化合物 624		δ 3.09 (t, J = 4.5Hz, 4H), 3.90 (t, J = 4.5Hz, 4H), 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.27 (dd, J = 2.5, 8.7Hz, 1H), 7.45 (d, J = 2.5Hz, 1H), 7.79 (s, 1H).		40.8

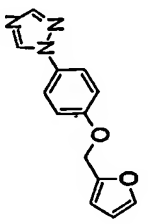
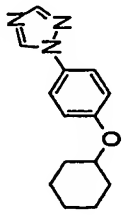
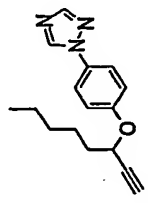
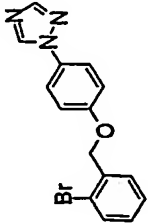
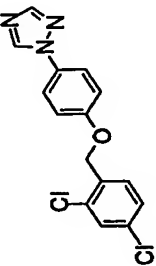
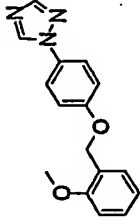
化合物 625		DMSO- d_6 , δ 2.29 (s, 6H), 2.89 brs, 6H), 3.57 (m, 2H), 4.41 (brt, J = 5.3Hz, 2H), 7.12 (brd, J = 7.9Hz, 4H), 7.25 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.9Hz, 4H), 7.77 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.93 (t, J = 1.5Hz, 1H), 8.24 (t, J = 1.5Hz, 1H), 9.63 (d, J = 1.5Hz, 1H). mp 161.0–164.0 °C	19.4	387.4
化合物 626		DMSO- d_6 , δ 2.76 (s, 3H), 2.77 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 3.80–3.91 (m, 4H), 4.25 (m, 2H), 7.21 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.76 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.91 (dd, J = 1.3, 1.9Hz, 1H), 8.24 (dd, J = 1.5, 1.9Hz, 1H), 9.71 (dd, J = 1.3, 1.5Hz, 1H). mp 174.0–179.0 °C	57.2	9.0
化合物 627		DMSO- d_6 , δ 1.00 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.52 (m, 2H), 1.83 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 4.04 (t, J = 6.4Hz, 2H), 7.18–7.27 (m, 4H), 7.42 (s, 1H), 7.88 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H). mp 148.0–149.0 °C		>300.0
化合物 628		DMSO- d_6 , δ 0.95 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.45 (tq, J = 7.3, 7.7Hz, 2H), 1.67–1.80 (m, 2H), 2.17 (d, J = 0.9Hz, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.5Hz, 2H), 7.09–7.21 (m, 4H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.55 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 9.25 (d, J = 1.5Hz, 1H). mp 163.0–164.0 °C		3.4
化合物 629		δ 0.99 (t, J = 7.3Hz, 3H), 1.45 (tq, J = 7.3, 7.7Hz, 2H), 1.72–1.83 (m, 2H), 2.17 (d, J = 0.9Hz, 3H), 3.99 (t, J = 6.5Hz, 2H), 6.92–7.00 (m, 1H), 6.96 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.26 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.66 s, 1H). mp 130.0–130.5 °C		173.1
化合物 630		DMSO- d_6 , δ 1.21 (t, J = 7.0Hz, 3H), 2.17 (s, 3H), 3.11–3.50 (m, 8H), 3.55 (t, J = 4.8Hz, 2H), 4.09 (q, J = 7.0Hz, 2H), 4.52 (t, J = 4.8Hz, 2H), 7.25 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.56–7.64 (m, 3H), 9.26 (s, 1H). mp 212.0–214.5 °C		56.5

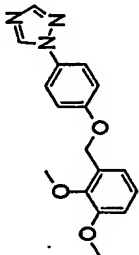
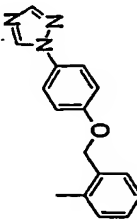
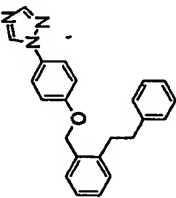
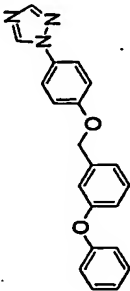
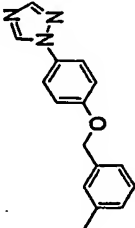
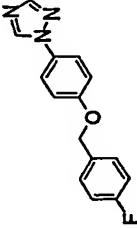
化合物 631		DMSO-d ₆ , δ 1.21 (t, J = 7.2Hz, 3H), 3.00–3.83 (m, 8H), 3.56 (t, J = 4.8Hz, 2H), 4.09 (q, J = 7.2Hz, 2H), 4.54 (t, J = 4.7Hz, 2H), 7.26 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.78 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.89 (dd, J = 1.4, 1.9Hz, 1H), 8.21 (dd, J = 1.4, 1.9Hz, 1H), 9.64 (t, J = 1.4Hz, 1H). mp 199.5–202.0 °C	16.2
化合物 632		δ 0.38 (q, J = 6.1Hz, 2H) 0.68 (q, J = 5.9Hz, 2H), 1.30 (m, 1H), 3.85 (d, J = 7.0Hz, 2H), 7.01 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.56 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	35.3
化合物 633		δ 4.30–4.40 (m, 4H), 6.97 (d, J = 7.6Hz, 2H), 7.08 (m, J_{AB} = 8.8Hz, 2H), 7.23–7.36 (m 3H), 7.59 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46(s, 1H).	32.1
化合物 634		δ 1.21 (s, 3H), 1.23 (s, 3H), 3.70 (m, 1H), 3.81 (t, J = 4.7Hz, 2H), 4.16 (t, J = 4.8Hz, 2H), 7.04 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.56 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	8.4
化合物 635		δ 3.40 (s, 3H), 3.59 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.74 (t, J = 4.8Hz, 2H), 3.89 (t, J = 5.0Hz, 2H), 4.19 (t, J = 5.0Hz, 2H), 7.03 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.56 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	16.9
化合物 636		δ 1.23 (t, J = 7.0Hz, 3H), 3.55 (q, J = 7.0Hz, 2H), 3.60–3.77(m, 4H), 3.89 (t, J = 5.3Hz, 2H), 4.19 (t, J = 5.0Hz, 2H), 7.04 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.56 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	26.4

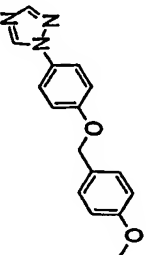
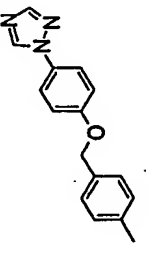
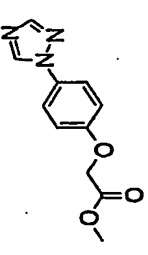
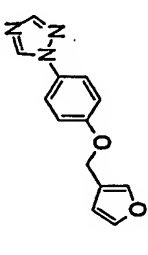
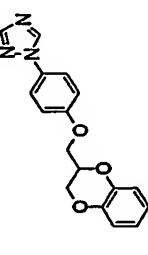
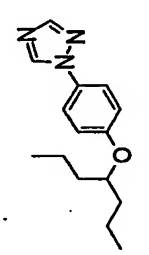
化合物 637		δ 3.14 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 3.86 (s, 3H), 4.20 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 6.85–6.90 (m, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.20–7.28 (m, 2H), 7.54 (m, $J_{AB} = 8.7\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	84.6	
化合物 638		δ 2.24 (s, 3H), 2.92 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.21 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	31.7	
化合物 639		δ 1.31 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 2.67 (q, $J = 7.3\text{Hz}$, 2H), 2.94 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.19 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	48.1	
化合物 640		δ 2.56 (t, $J = 2.3\text{Hz}$, 1H), 4.76 (d, $J = 2.3\text{Hz}$, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.60 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.47 (s, 1H).		
化合物 641		δ 1.88 (t, $J = 2.2\text{Hz}$, 3H), 4.71 (q, $J = 2.2\text{Hz}$, 2H), 7.09 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	21.7	
化合物 642		δ 1.78 (d, $J = 6.4\text{Hz}$, 3H), 4.60 (d, $J = 5.8\text{Hz}$, 2H), 5.70–5.85 (m, 2H), 6.10 (m, 1H), 6.36 (m, 1H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	43.1	

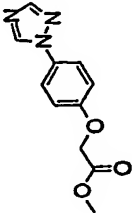
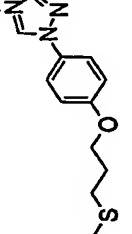
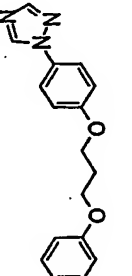
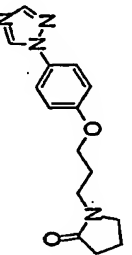
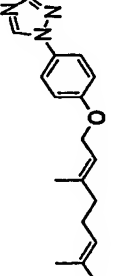
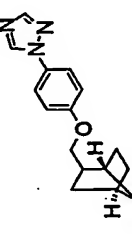
化合物 643		δ 1.06 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 3H), 1.78–1.92 (m, 2H), 3.97 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	33.0	
化合物 644		δ 2.12 (m, 2H), 2.79 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 4.00 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.70–6.83 (m, 3H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	45.2	
化合物 645		δ 2.10 (m, 2H), 2.78 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.99 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 6.84 (m, $J_{AB} = 8.5\text{Hz}$, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.13 (m, $J_{AB} = 8.4\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	61.3	
化合物 646		δ 1.81 (t, $J = 2.6\text{Hz}$, 3H), 2.60–2.71 (m, 2H), 4.09 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	24.3	
化合物 647		δ 2.03–2.15 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.68 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.03 (t, $J = 6.1\text{Hz}$, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	60.5	
化合物 648		δ 0.93 (s, 3H), 0.95 (s, 3H), 1.30–1.40 (m, 2H), 1.63 (m, 1H), 1.75–1.87 (m, 2H), 3.99 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	68.1	

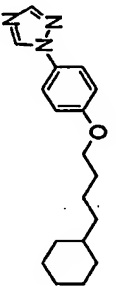
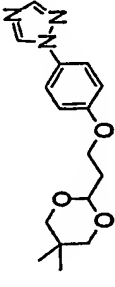
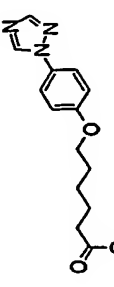
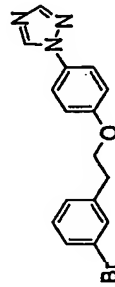
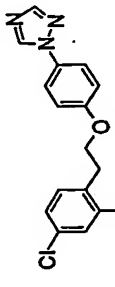
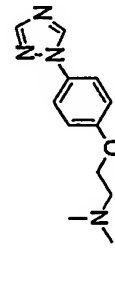
化合物 649		δ 1.75-1.93 (m, 4H), 2.71 (t, J = 6.8Hz, 2H), 4.01 (t, J = 6.1Hz, 2H), 6.99 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.15-7.33 (m, 5H), 7.55 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44(s, 1H).	80.7	
化合物 650		δ 1.85-1.98 (m, 2H), 2.21-2.32 (m, 2H), 4.02 (t, J = 6.5Hz, 2H), 4.98-5.13 (m, 2H), 5.87 (m, 1H), 7.00 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.56 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	66.2	
化合物 651		δ 1.45-1.90 (m, 6H), 2.66 (t, J = 7.8Hz, 2H), 4.00 (t, J = 6.4Hz, 2H), 6.99 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.16-7.34 (m, 5H), 7.55 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44(s, 1H).	60.8	
化合物 652		δ 0.90 (t, J = 6.4Hz, 3H), 1.25-1.55 (m, 8H), 1.75-1.88 (m, 2H), 4.00 (t, J = 6.5Hz, 2H), 7.00 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.55 (m, J_{AB} = 8.5Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44(s, 1H).	52.7	
化合物 653		δ 0.89 (t, J = 6.7Hz, 3H), 1.23-1.54 (m, 10H), 1.75-1.88 (m, 2H), 4.00 (t, J = 6.5Hz, 2H), 7.00 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 7.55 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44(s, 1H).		
化合物 654		δ 3.85-4.15 (m, 4H), 4.46 (m, 1H), 4.96 (s, 1H), 5.11 (s, 1H), 7.04 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 7.58 (m, J_{AB} = 8.9Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	33.5	

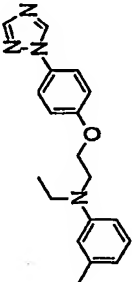
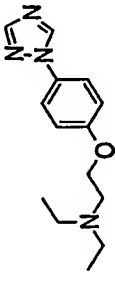
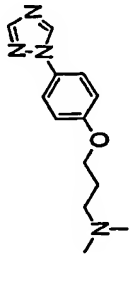
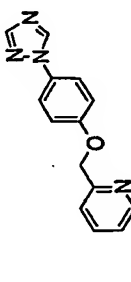
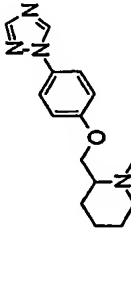
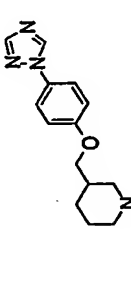
化合物 655		δ 5.06 (s, 2H), 6.40 (m, 1H), 6.46 (m, 1H), 7.10 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.47 (d, $J = 1.9\text{Hz}$, 1H), 7.58 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	56.5	
化合物 656		δ 1.24-1.68 (m, 6H), 1.75-1.90 (m, 2H), 1.95-2.08 (m, 2H), 4.29 (m, 1H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.54 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	47.7	
化合物 657		δ 0.85-1.00 (m, 3H), 1.23-1.68 (m, 6H), 1.88-2.08 (m, 2H), 2.51 (d, $J = 2.0\text{Hz}$, 1H), 4.76 (m, 1H), 7.13 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	44.7	
化合物 658		δ 5.19 (s, 2H), 7.10 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.16-7.38 (m, 2H), 7.51-7.63 (m, 4H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	67.6	
化合物 659		δ 5.18 (s, 2H), 7.09 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.30 (dd, $J = 2.0\text{Hz}$, 8.2Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 2.0\text{Hz}$, 1H), 7.50 (d, $J = 8.2\text{Hz}$, 1H), 7.60 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	60.8	
化合物 660		δ 3.89 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.92-7.04 (m, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.33 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 1H), 7.45 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	49.6	

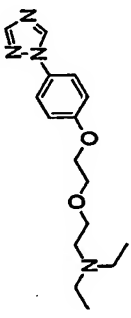
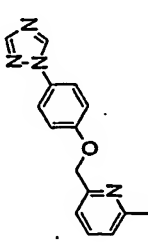
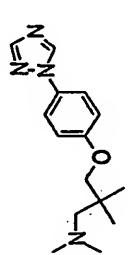
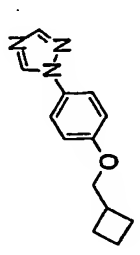
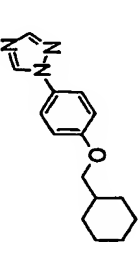
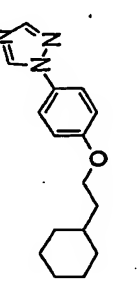
化合物 661		δ 3.90 (s, 6H), 5.17 (s, 2H), 6.93 (dd, $J = 2.3\text{Hz}$, 7.3Hz, 1H), 7.04-7.15 (m, 4H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	31.6	
化合物 662		δ 2.40 (s, 3H), 5.09 (s, 2H), 7.10 (m, $J_{AB}=9.0\text{Hz}$, 2H), 7.20-7.33 (m, 3H), 7.41 (d, $J = 7.5\text{Hz}$, 1H), 7.58 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	72.2	
化合物 663		δ 2.90-3.08 (m, 4H), 4.98 (s, 2H), 7.04 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.09-7.44 (m, 9H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	41.8	
化合物 664		δ 5.09 (s, 2H), 6.94-7.20 (m, 8H), 7.29-7.38 (m, 3H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	43.0	
化合物 665		δ 2.38 (s, 3H), 5.08 (s, 2H), 7.08 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.16 (d, $J = 7.3\text{Hz}$, 1H), 7.20-7.33 (m, 3H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45(s, 1H).	99	
化合物 666		δ 5.08 (s, 2H), 7.04-7.14 (m, 4H), 7.38-7.46 (m, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	99.4	

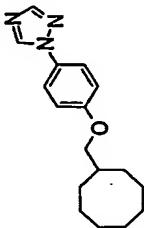
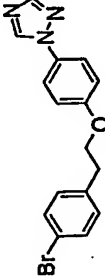
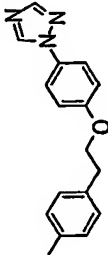
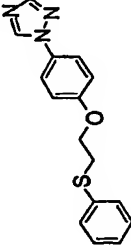
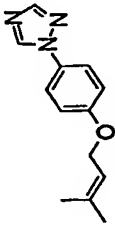
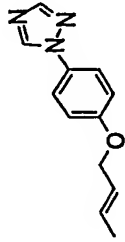
化合物 667		δ 3.83 (s, 3H), 5.04 (s, 2H), 6.93 (m, $J_{AB} = 8.7\text{Hz}$, 2H), 7.07 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.37 (m, $J_{AB} = 8.4\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	69.9	
化合物 668		δ 2.37 (s, 3H), 5.08 (s, 2H), 7.07 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.21 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.33 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	86.8	
化合物 669		δ 3.83 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 7.03 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.47 (s, 1H).	15.5	
化合物 670		δ 5.00 (s, 2H), 6.51 (t, $J = 0.8\text{Hz}$, 1H), 7.07 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.46 (t, $J = 1.6\text{Hz}$, 1H), 7.53 (t, $J = 0.8\text{Hz}$, 1H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	46.1	
化合物 671		δ 4.15-4.65 (m, 5H), 6.84-6.96 (m, 4H), 7.05 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.59 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).	89.6	
化合物 672		δ 0.94 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 1.25-1.76 (m, 8H), 4.29 (m, 1H), 6.99 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.53 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).		

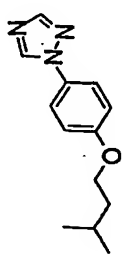
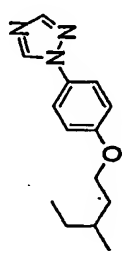
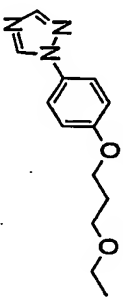
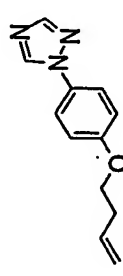
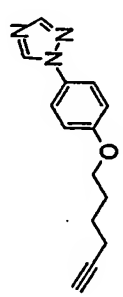
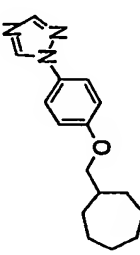
化合物 673		δ 3.83 (s, 3H), 4.70 (s, 2H), 7.03 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.60 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H).		
化合物 674		δ 2.06-2.17 (m, 5H), 2.71 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.12 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	41.3	
化合物 675		δ 2.24-2.36 (m, 2H), 4.15-4.28 (m, 4H), 6.90-7.06 (m, 5H), 7.25-7.28 (m, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	57.0	
化合物 676		δ 1.99-2.11 (m, 4H), 2.40 (t, $J = 7.9\text{Hz}$, 2H), 3.40-3.55 (m, 4H), 4.04 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 8.9\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	41.4	
化合物 677		δ 1.61 (s, 3H), 1.68 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.08-2.13 (m, 4H), 4.59 (d, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 5.10 (m, 1H), 5.49 (dd, $J = 5.4, 7.6\text{Hz}$, 1H), 7.02 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	80.6	
化合物 678		δ 0.75-1.97 (m, 9H), 2.17-2.40 (m, 2H), 3.67-4.02 (m, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	85.6	

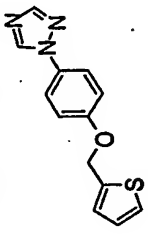
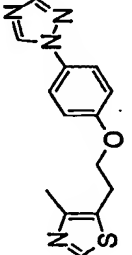
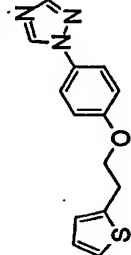
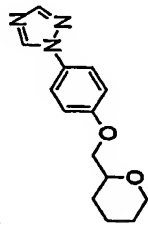
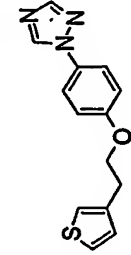
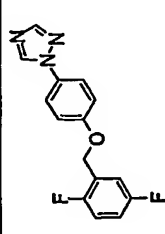
化合物 679		δ 0.86–0.94 (m, 2H), 1.08–1.27 (m, 6H), 1.43–1.53 (m, 2H), 1.68–1.83 (m, 7H), 4.00 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	29.2
化合物 680		δ 0.74 (s, 3H), 1.21 (s, 3H), 2.11–2.19 (dt, $J = 5.1$, 6.4Hz, 2H), 3.46 (d, $J = 11.2\text{Hz}$, 2H), 3.63 (d, $J = 11.2\text{Hz}$, 2H), 4.15 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 4.70 (t, $J = 5.1\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	36.1
化合物 681		δ 1.26 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 3H), 1.50–1.58 (m, 2H), 1.67–1.78 (m, 2H), 1.79–1.89 (m, 2H), 2.35 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 4.01 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 4.14 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	81.1
化合物 682		δ 3.10 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.21 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.17–7.25 (m, 2H), 7.38–7.41 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	72.2
化合物 683		δ 3.23 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.22 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.20–7.30 (m, 2H), 7.41 (d, $J = 2.0\text{Hz}$, 1H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	68.3
化合物 684		δ 2.37 (s, 6H), 2.77 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 4.12 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	28.4

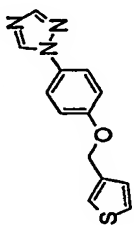
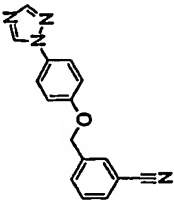
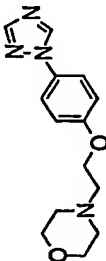
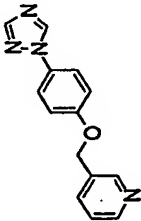
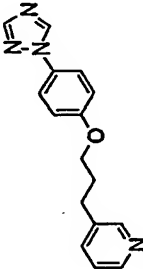
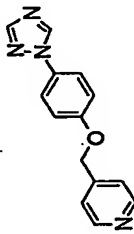
化合物 685		δ 1.21 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 3H), 2.32 (s, 3H), 3.48 (q, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 3.74 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 4.16 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.52–6.55 (m, 3H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.13 (dd, $J = 7.2$, 9.0Hz , 1H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	76.3
化合物 686		δ 1.09 (t, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 2.67 (q, $J = 7.2\text{Hz}$, 4H), 2.91 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 4.10 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	
化合物 687		δ 1.99–2.03 (m, 2H), 2.30 (s, 6H), 2.51 (t, $J = 7.6\text{Hz}$, 2H), 4.07 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	11.0
化合物 688		δ 5.26 (s, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.24–7.28 (m, 1H), 7.51–7.55 (m, 1H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.74 (dt, $J = 1.7$, 7.8Hz , 1H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.62 (d, $J = 4.8\text{Hz}$, 1H).	34.8
化合物 689		δ 1.66–1.87 (m, 6H), 2.43 & 2.39 (s, 3H), 2.60–2.91 (m, 3H), 4.05–4.54 (m, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	23.4
化合物 690		δ 1.13–2.31 (m, 7H), 2.31 (s, 3H), 2.76–2.80 (m, 1H), 2.96–2.99 (m, 1H), 3.82–3.91 (m, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	26.5

化合物 691		δ 1.05 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 3H), 2.61–2.73 (m, 6H), 3.56–3.69 (m, 4H), 3.83–3.87 (m, 2H), 4.16–4.19 (m, 4H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	9.3	
化合物 692		δ 2.59 (s, 3H), 5.22 (s, 1H), 7.03–7.13 (m, 3H), 7.32 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 1H), 7.55–7.65 (m, 3H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H).	26.1	
化合物 693		δ 1.02 (s, 6H), 2.29 (s, 8H), 3.76 (s, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.44 (s, 1H).	20.3	
化合物 694		δ 1.84–2.22 (m, 6H), 2.76–2.87 (m, 1H), 3.98 (d, $J = 6.6\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 71.0–72.5 °C	63.5	28.0
化合物 695		δ 0.99–1.49 (m, 5H), 1.64–1.96 (m, 6H), 3.80 (t, $J = 5.9\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 80.0–83.0 °C	85.5	5.7
化合物 696		δ 0.96–1.80 (m, 13H), 4.04 (t, $J = 6.7\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 88.0–89.0 °C	88.9	8.0

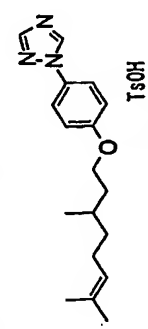
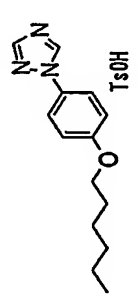
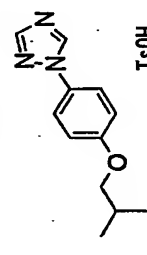
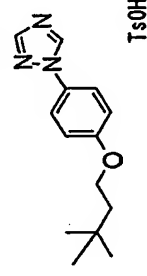
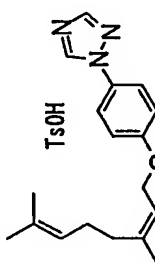
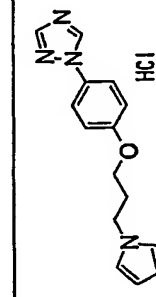
化合物 697		δ 1.36–1.92 (m, 14H), 2.05 (m, 1H), 3.77 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 83.0–85.0 °C	80.5	5.3
化合物 698		δ 3.08 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.20 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.99 (m, $J_{AB} = 9.1\text{Hz}$, 2H), 7.18 (m, $J_{AB} = 8.4\text{Hz}$, 2H), 7.46 (m, $J_{AB} = 8.4\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.1\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 117.0–118.0 °C	81.9	12.4
化合物 699		δ 2.34 (s, 3H), 3.09 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.20 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.12–7.21 (m, 4H), 7.56 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 128.5–130.5 °C	78.8	10.7
化合物 700		δ 3.32 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 4.19 (t, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 6.96 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.40–7.46 (m, 5H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 123.5–124.5 °C	78.0	10.0
化合物 701		δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 4.57 (d, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 5.50 (m, 1H), 7.03 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 68.0–70.0 °C	64.4	8.9
化合物 702		(200 MHz, $DMSO-d_6$), δ 1.66–1.76 (m, 3H), 4.50–4.58 (m, 2H), 5.60–5.99 (m, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 7.75 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 8.19 (s, 1H), 9.17 (s, 1H). mp 105.0–107.0 °C	70.7	20.0

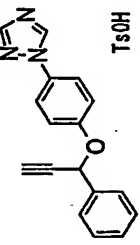
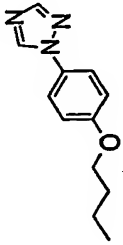
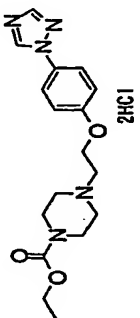
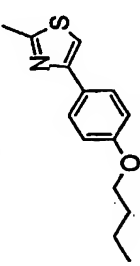
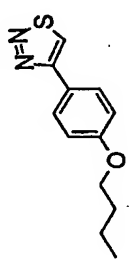
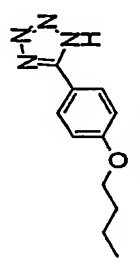
化合物 703		(200 MHz, DMSO- d_6), δ 0.93 (s, 3H), 0.96 (s, 3H), 1.56-1.91 (m, 3H), 4.05 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 7.75 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.19 (s, 1H), 9.17 (s, 1H). mp 74.5-75.5 °C	91.3	6.2
化合物 704		(200 MHz, DMSO- d_6), δ 0.80-0.99 (m, 6H), 1.06-1.90 (m, 5H), 3.95-4.16 (m, 2H), 7.11 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 7.75 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.19 (s, 1H), 9.17 (s, 1H). mp 57.0-58.0 °C	94.0	4.4
化合物 705		δ 1.21 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 2.08 (quint, $J = 6.2$ Hz, 2H), 3.52 (q, $J = 7.0$ Hz, 2H), 3.59 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 4.12 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 46.0-49.0 °C	64.0	19.9
化合物 706		δ 2.53-2.63 (m, 2H), 4.07 (t, $J = 6.6$ Hz, 2H), 5.11-5.25 (m, 2H), 5.92 (ddt, $J = 6.6, 10.3, 17.1$ Hz, 1H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 60.5-62.0 °C	46.3	158.0
化合物 707		δ 1.70-1.78 (m, 2H), 1.92-1.99 (m, 2H), 1.98 (t, $J = 2.6$ Hz, 1H), 2.30 (dt, $J = 2.6, 6.8$ Hz, 2H), 4.05 (t, $J = 6.2$ Hz, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.8$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 84.0-85.0 °C	70.6	7.6
化合物 708		δ 1.23-2.05 (m, 13H), 3.78 (d, $J = 6.6$ Hz, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.55 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 81.0-83.0 °C	83.3	6.7

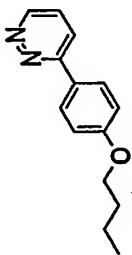
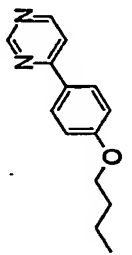
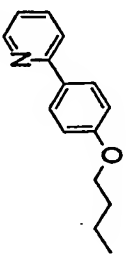
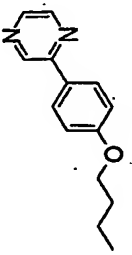
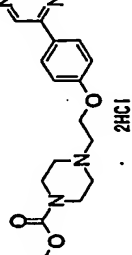
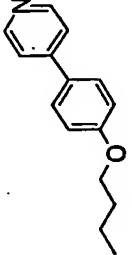
化合物 709		δ 5.29 (s, 2H), 7.01–7.16 (m, 4H), 7.36 (dd, $J = 1.3, 5.0\text{Hz}$, 1H), 7.59 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 114.0–115.5 °C	68.0	25.8
化合物 710		δ 2.47 (s, 3H), 3.29 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 3H), 4.19 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.62 (s, 1H). mp 88.0–90.5 °C	81.1	1.7
化合物 711		δ 3.35 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.25 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 6.93–7.00 (m, 2H), 7.03 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.20 (m, 1H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 80.0–82.0 °C	71.9	32.7
化合物 712		δ 1.45–1.95 (m, 6H), 3.47–3.77 (m, 1H), 3.90–4.11 (m, 3H), 7.05 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 69.0–71.5 °C	46.4	102.0
化合物 713		δ 3.16 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 4.23 (t, $J = 6.8\text{Hz}$, 2H), 7.02 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 7.04–7.12 (m, 2H), 7.29–7.33 (m, 1H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.2\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 85.5–87.5 °C	95.5	7.8
化合物 714		δ 5.17 (s, 2H), 6.99–7.15 (m, 4H), 7.25 (m, 1H), 7.60 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.47 (s, 1H). mp 120.0–122.0 °C	78.3	37.2

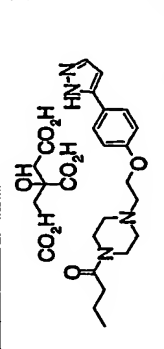
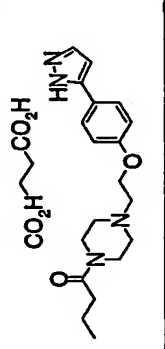
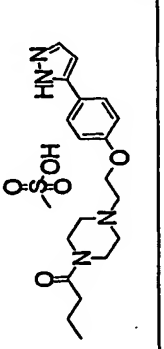
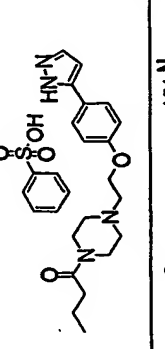
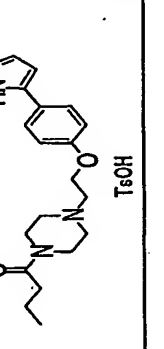
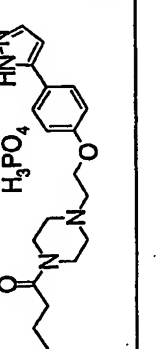
化合物 715		δ 5.14 (s, 2H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.17 (dd, $J = 1.8, 4.8\text{Hz}$, 1H), 7.36–7.40 (m, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 128.0–130.0 °C	73.5	13.0
化合物 716		δ 5.16 (s, 2H), 7.08 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.50–7.71 (m, 5H), 7.78 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.48 (s, 1H). mp 135.0–136.5 °C	77.9	9.3
化合物 717		δ 2.62 (m, 4H), 2.84 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 3.76 (m, 4H), 4.16 (t, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 7.03 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.58 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H). mp 96.0–97.0 °C	27.5	754.3
化合物 718		δ 5.15 (s, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.35 (dd, $J = 4.8, 7.9\text{Hz}$, 1H), 7.61 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.78–7.82 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.62 (dd, $J = 1.6, 4.8\text{Hz}$, 1H), 8.72 (d, $J = 1.8\text{Hz}$, 1H). mp 123.5–124.5 °C	60.6	49.6
化合物 719		δ 2.19 (ddt, $J = 6.2, 7.3, 8.1\text{Hz}$, 2H), 2.86 (dd, $J = 7.3, 8.1\text{Hz}$, 2H), 4.02 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 7.00 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.23 (dd, $J = 5.1, 7.9\text{Hz}$, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 8.8\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.46–8.52 (m, 2H). mp 81.0–83.0 °C	81.2	15.4
化合物 720		δ 5.16 (s, 2H), 7.08 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.38 (d, $J = 5.5\text{Hz}$, 2H), 7.61 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.10 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.64–8.67 (m, 2H). mp 149.5–151.0 °C	56.4	78.2

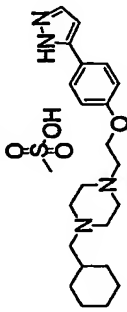
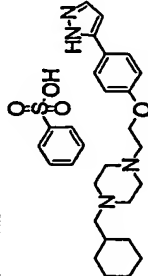
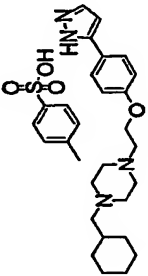
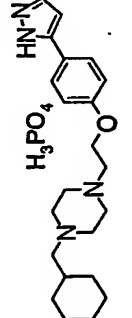
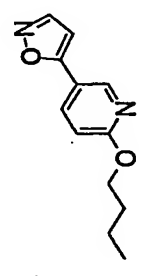
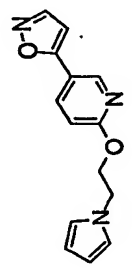
化合物 721		δ 1.34–1.59 (m, 6H), 1.81 (m, 2H); 2.22 (s, 6H), 2.27 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 4.00 (t, $J = 6.5\text{Hz}$, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 66.0–68.0 °C	63.7	29.3
化合物 722		δ 2.20 (ddt, $J = 6.2, 7.3, 7.9\text{Hz}$, 2H), 2.85 (dd, $J = 7.3, 7.9\text{Hz}$, 2H), 4.02 (t, $J = 6.2\text{Hz}$, 2H), 6.99 (m, $J = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.16 (d, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H), 7.57 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.53 (d, $J = 5.7\text{Hz}$, 2H). mp 150.5–152.0 °C	56.3	25.2
化合物 723		δ 4.23–4.35 (m, 4H), 6.18–6.20 (m, 2H), 6.77–6.79 (m, 2H), 6.98 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.08 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 90.0–91.5 °C	78.9	32.5
化合物 724		δ 0.99–1.91 (m, 11H), 1.20(d, $J = 6.2\text{Hz}$, 3H), 2.29 (s, 3H), 4.31–4.34 (m, 1H), 7.07–7.13 (m, 4H), 7.47 (m, $J_{AB} = 8.4\text{Hz}$, 2H), 7.72 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.19 (s, 1H), 9.16 (s, 1H). mp 161.5–163.0 °C	72.5	15.5
化合物 725		DMSO- d_6 , δ 0.88 (t, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H), 1.20–1.58 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 3.46 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 3.66–3.76 (m, 2H), 4.15–4.20 (m, 2H), 7.08–7.18 (m, 4H), 7.50 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.76 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.27 (s, 1H), 9.28 (s, 1H). mp 140.0–141.0 °C	49.7	127.8
化合物 726		DMSO- d_6 , δ 1.43–1.83 (m, 4H), 2.03–2.18 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.04 (t, $J = 6.4\text{Hz}$, 2H), 4.93–5.10 (m, 2H), 5.83 (m, 1H), 7.05–7.16 (m, 4H), 7.43 (d, $J = 8.1\text{Hz}$, 2H), 7.75 (m, $J_{AB} = 9.0\text{Hz}$, 2H), 8.22 (s, 1H), 9.22 (s, 1H). mp 164.5–165.5 °C	79.9	4.9

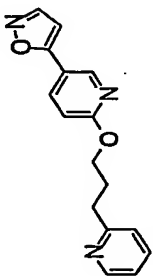
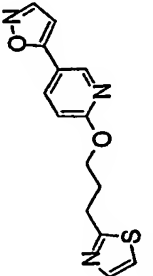
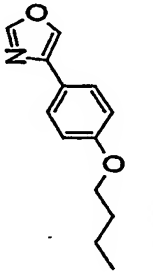
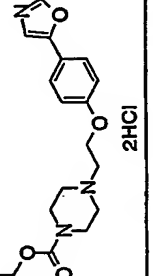
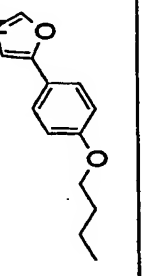
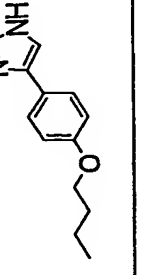
化合物 727		δ 0.93 (d, J = 6.2Hz, 3H), 1.57 (s, 3H), 1.65 (s, 3H), 1.91–1.98 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.06 (t, J = 6.8Hz, 2H), 5.10 (t, J = 7.3Hz, 1H), 7.07–7.14 (m, 4H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 9.21 (s, 1H). mp 154.0–156.0 °C	80.7	10.9
化合物 728		δ 0.89 (t, J = 6.8Hz, 3H), 1.27–1.46 (m, 6H), 1.66–1.76 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.02 (t, J = 6.5Hz, 2H), 7.06–7.14 (m, 4H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.21 (s, 1H), 9.20 (s, 1H). mp 167.0–168.5 °C	78.9	4.7
化合物 729		δ 1.02 (d, J = 6.8Hz, 6H), 2.04 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 3.81 (d, J = 6.6Hz, 2H), 7.09–7.15 (m, 4H), 7.49 (m, J_{AB} = 7.9Hz, 2H), 7.76 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.26 (s, 1H), 9.27 (s, 1H). mp 196.0–197.5 °C	44.3	78.2
化合物 730		δ 0.98 (s, 9H), 1.68 (t, J = 7.3Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 4.08 (t, J = 7.3Hz, 2H), 7.08–7.14 (m, 4H), 7.48 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.75 (m, J_{AB} = 9.0Hz, 2H), 8.22 (s, 1H), 9.21 (s, 1H). mp 201.0–203.5 °C	83.3	5.2
化合物 731		δ 1.57 (d, J = 0.9Hz, 3H), 1.63 (s, 3H), 1.76 (d, J = 1.1Hz, 3H), 2.08–2.29 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 4.58 (dd, J = 0.9, 6.7Hz, 2H), 5.13 (m, 1H), 5.47 (dd, J = 1.3, 6.7Hz, 1H), 7.07–7.16 (m, 4H), 7.49 (m, J_{AB} = 8.1Hz, 2H), 7.76 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 8.28 (s, 1H), 9.28 (s, 1H). mp 215 °C (dec.)	71.6	11.8
化合物 732		DMSO- d_6 , δ 2.09–2.20 (m, 2H), 3.94 (t, J = 6.1Hz, 2H), 4.07 (t, J = 7.0Hz, 2H), 5.98 (t, J = 2.2Hz, 2H), 6.76 (t, J = 2.2Hz, 2H), 7.10 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 7.76 (m, J_{AB} = 9.2Hz, 2H), 8.24 (s, 1H), 9.24 (s, 1H). mp 185.0–187.5 °C	75.7	38.0

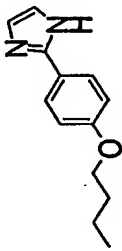
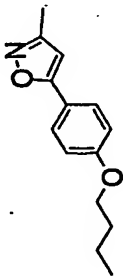
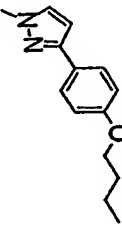
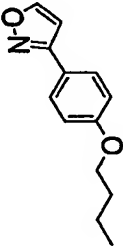
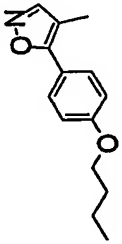
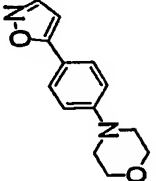
化合物 733		δ 2.29 (s, 3H), 3.85 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 6.32 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.13 (d, $J = 7.9$ Hz, 2H), 7.28 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 7.42–7.55 (m, 5H), 7.60–7.65 (m, 2H), 7.80 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 8.27 (s, 1H), 9.27 (s, 1H). mp 121.0–123.0 °C	79.0	22.6
化合物 734		δ 1.00 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H), 1.43–1.61 (m, 2H), 1.74–1.88 (m, 2H), 4.02 (t, $J = 6.5$ Hz, 2H), 7.01 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 7.56 (m, $J_{AB} = 9.0$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.45 (s, 1H). mp 59.0–60.5 °C	62.0	60.2
化合物 735		(200 MHz, DMSO- d_6), δ 1.21 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H), 3.06–3.64 (m, 8H), 4.00–4.14 (m, 4H), 4.48 (t, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.19 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 7.81 (m, $J_{AB} = 9.2$ Hz, 2H), 8.21 (s, 1H), 9.21 (s, 1H). mp 193.5–198.0 °C		>300.0
化合物 736		mp 71.0–72.0 °C		>1000 0
化合物 737		mp 82.0–83.0 °C		1417.8
化合物 738		mp 198.5–200.0 °C		>1,000

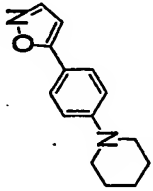
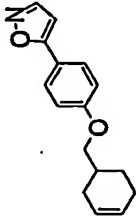
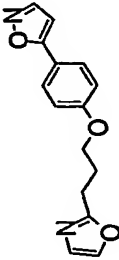
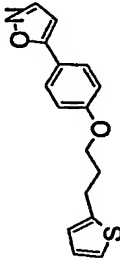
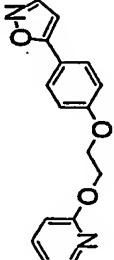
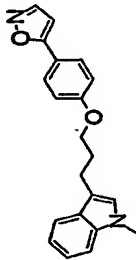
化合物 739		mp 97.5-98.5 °C		>1,000
化合物 740		mp 81.5-82.5 °C		>1,000
化合物 741		mp 47.0-48.5 °C		>1,000
化合物 742		mp 72.0-74.5 °C		82.1
化合物 743		mp 204.0-204.5 °C (dec.)		15.5
化合物 744		mp 58.5-59.5 °C		704.3

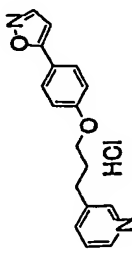
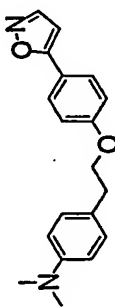
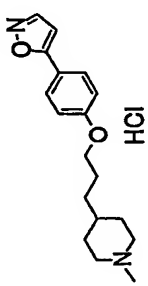
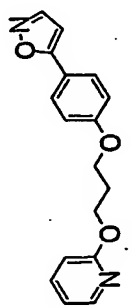
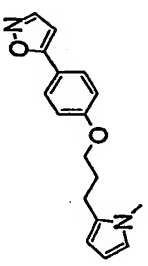
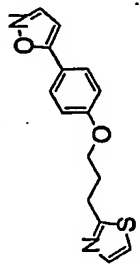
化合物 757		mp 135.0–139.0 °C		
化合物 758		mp 111.0–113.0 °C		
化合物 759		mp 176.0–177.0 °C		
化合物 760		mp 150.5–151.0 °C		
化合物 761		mp 145.0–146.5 °C		
化合物 762		測定不能		

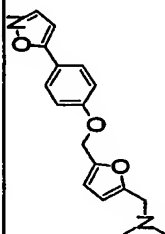
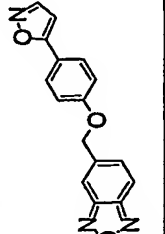
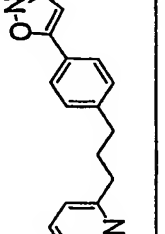
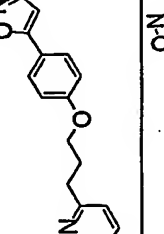
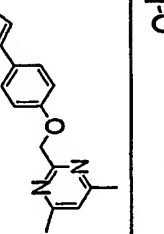
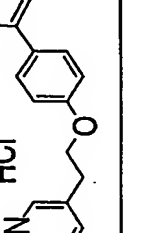
化合物 763		mp 176.5–177.5 °C		
化合物 764		mp 196.5–197.5 °C		
化合物 765		mp 198.0–199.0 °C		
化合物 766		mp 209.0–210.5 °C		
化合物 767		mp 46.0–49.0 °C	>316	
化合物 768		mp 112.5–113.5 °C (dec.)		98

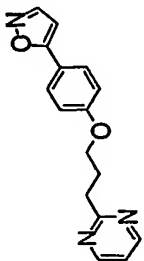
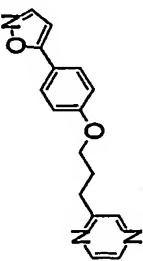
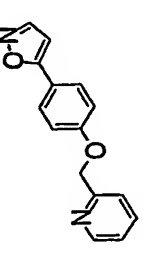
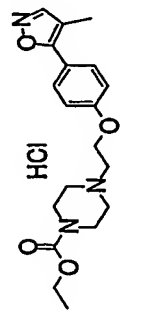
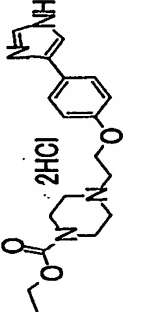
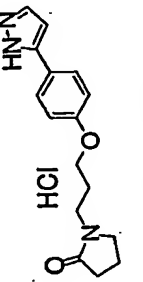
化合物 769		mp 88.0-89.5 °C	111.1
化合物 770		mp 60.0-62.0 °C	>316
化合物 771		mp 52.0-52.5 °C	>1,000
化合物 772		mp 195.0-197.0 °C (dec.)	53
化合物 773		mp 57.5-59.0 °C	6.3
化合物 774		mp 120.0-122.0 °C	

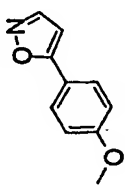
化合物 775		mp 172.0-173.0°C			
化合物 776		mp 77.5-79.0°C			
化合物 777		mp 57.0-59.5°C			
化合物 778		mp 34.5-35.5°C			
化合物 779		mp 71.0-72.0°C			
化合物 780		mp 161.0-162.0°C			

化合物 781		mp 143.5–144.5°C			
化合物 782		mp 69.0–70.5°C			
化合物 783		mp 93.0–94.0°C			
化合物 784		mp 76.0–78.0°C			
化合物 785		mp 100.0–102.0°C			
化合物 786		mp 118.5–119.0°C			

化合物 787	 <chem>C1=CC=C(C=C1)OCC2=CC=CC=C2N3=CC=CC=C3.[Cl-]</chem>	mp 172.0–174.0°C (dec)		
化合物 788	 <chem>CN(C)C1=CC=C(C=C1)COCC2=CC=CC=C2OCC3=CC=CC=C3N4=CC=CC=C4</chem>	mp 84.0–89.0°C		
化合物 789	 <chem>CN(C)CC1=CC=C(C=C1)COCC2=CC=CC=C2OCC3=CC=CC=C3N4=CC=CC=C4.[Cl-]</chem>	mp 184.0–188.0 °C (dec)		
化合物 790	 <chem>C1=CC=C(C=C1)OCC2=CC=CC=C2N3=CC=CC=C3OCC4=CC=CC=C4N5=CC=CC=C5</chem>	mp 88.0–89.0°C		
化合物 791	 <chem>C1=CC=C(C=C1)OCC2=CC=CC=C2N3=CC=CC=C3OCC4=CC=CC=C4N5=CC=CC=C5</chem>	mp 80.0–81.5°C		
化合物 792	 <chem>C1=CC=C(C=C1)OCC2=CC=CC=C2N3=CC=CC=C3OCC4=CC=CC=C4N5=CC=CC=C5S6=CC=CC=C6</chem>	mp 94.0–95.5°C		

化合物 793		mp 158.0–160.0°C (dec.)		
化合物 794		mp 156.0–158.0°C		
化合物 795		mp 160.0–164.0°C		
化合物 796		mp 86.5–88.0°C		
化合物 797		mp 94.5–96.0°C		
化合物 798		mp 149.0–153.0°C		

化合物 799		mp 105.0–109.0°C (dec.)		
化合物 800		mp 100.0–103.0°C (dec.)		
化合物 801		mp 71.0–75.0°C		
化合物 802		mp 202.0–204.0°C (dec.)		
化合物 803		mp 196.0–198.0 °C		
化合物 804		mp 163.0–165.0 °C		

对照化合物1	 <chem>COc1ccc(cc1)-c2cc[nH]n2</chem>	J. Org. Chem., 45 (1980) 4857. mp 62.0-64.0 °C		>1,000
--------	---	--	--	--------

試験例 [ヒト腎ミクロソーム由来 20-HETE 産生酵素の阻害作用]

上記表記載の化合物について、20-HETE 産生阻害作用を試験した。

本試験は J. Pharmacol. Exp. Ther., 第 268 巻, 474 頁, 1994 年に記載の方法に準拠して行った。

DMSO で $1\ \mu\text{M}$ に調製した被験薬溶液を、5 mM の塩化マグネシウム及び 1 mM のエチレンジアミンテトラアセティックアシッド ジソディウムソルト (EDTA) を含む 50 mM の 3-モルホリノプロパンスルホン酸 (MOPS) (pH 7.4) 緩衝液に加え、酵素源としてヒト腎ミクロソーム画分 (Human Cell Culture Center, Anatomic Gift Foundation)、基質として [5, 6, 8, 9, 11, 12, 14, 15] トリチウム-アラキドン酸、そして補酵素として NADPH を添加し、37 度で 1.5 時間反応させた。反応液にギ酸を添加して反応を停止させた後、アセトニトリル (終濃度 50%) を加えた。ODS カラム (バイオシル C18, バイオラッド社製) を装着した放射性物質検出器付き高速液体クロマトグラフィーを用いて 20-HETE の産生量を測定した。

化合物無添加時の 20-HETE の産生量を 100% とし、化合物を添加した時の 20-HETE 産生量から、抑制率 (%) を算出した。その結果を上記表に併せて示した。

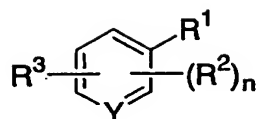
また、化合物無添加時の 20-HETE の産生量を 100% とし、化合物を添加した時の 20-HETE 産生が 50% 阻害される化合物濃度 (IC_{50} 値) も算出した。その結果についても上記表に併せて示した。

産業上の利用可能性

本発明に係る化合物は 20-HETE 産生阻害作用を有し、ヒト及び動物における 20-HETE が関わる疾病、例えば各種腎疾患、脳血管疾患、各種循環器疾患治療薬として有用である。

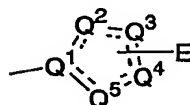
請求の範囲

1. 式

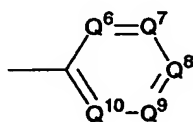


{式中、Yは炭素原子又は窒素原子であり、

R¹は式



[式中、Q¹～Q⁵のうち少なくとも1個は窒素原子であり、その他は炭素原子、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子であり、Eは水素原子又はC₁₋₄アルキル基である。]で表されるヘテロ環基又は式



[式中、Q⁶～Q¹⁰のうち1又は2個は窒素原子であり、その他は炭素原子である。]で表されるヘテロ環基であり、

R²は水素原子、C₁₋₄アルキル基、C₁₋₄アルコキシ基又はハロゲン原子であり、
nは1～4の整数であり、

R³はモルホリノ基、

ピロリジノ基、

4-C₁₋₆アルコキシカルボニルピペラジン-1-イループロピル基、

C₃₋₁₄アルコキシ基、

1～6個のハロゲン原子で置換されたC₂₋₁₄アルコキシ基、

C₃₋₁₀シクロアルコキシ基、
C₂₋₁₄アルケニルオキシ基、
C₃₋₁₄アルキニルオキシ基、
1-フェニル-2-プロピニルオキシ基
ビス(N,N-ジメチルアミノメチル)メトキシ基、
式 R⁴-A-O-

[式中、

AはC₁₋₁₀アルキレン基であり、

R⁴はC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルコキシ基、

C₁₋₁₀アルコキシ基、

C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキセタニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基、

ベンゾジオキサニル基、

C₁₋₆アルキルチオ基、

C₄₋₁₀シクロアルケニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基、

ピシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基、

ピロリル基、

フリル基、

チエニル基、

2-オキソピロリジン-1-イル基、

ジヒドロピラニル基、

カルバゾリル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基、

4-カルボキシピペリジノカルボニル基、

ピリジル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基又はピペリジノメチル基」で置換されたピリジル基、

2-ピリジルオキシ基、

フェニル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基」から選ばれる基で置換されたフェニル基、

チアゾリル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたチアゾリル基、

アミノ基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、

アニリノ基、

N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該アニリノ基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

ベンジルアミノ基、

N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキルアミノ基、

アジリジン-1-イル基、

モルホリノ基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、

ピペリジノ基、

「カルボキシル基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イル-カルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル基、ピロリジン-1-イルメチル基、モルホリノメチル基又はN,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基」で置換されたピペリジノ基、

ベルヒドロアゾシン-1-イル基、

ベルヒドロアゼピン-1-イル基、

イミダゾリン-2-オン-1-イル基、

オキサゾリジン-3-イル基、

1-C₁₋₆アルキル-2-オキソピペラジン-4-イル基、

フェノキシ基、

オキサゾリル基、

ビフェニル基、

フェニルチオ基

N-メチルインドール-3-イル基、

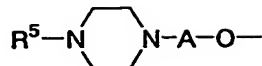
ベンゾ[1,2,5]オキサジアゾール基、

2-ピラジル基、

ピリミジル基又は

C₁₋₆アルキル基で置換されたピリミジル基である。]で表される基

又は式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R⁵は水素原子、

C₁₋₆アルキル基、

ヒドロキシエチル基、

オキサニルメチル基、

ピリジルメチル基、

2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基、

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基、

4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、

N-アセチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

オキサニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イルカルボニル基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基、

3-(4-メチルシクロヘキシル)プロピオニル基、

2-(2-オキソピロリジン-1-イル)アセチル基、

3-メチル-2-ブテノイル基、

カルバモイル基、

「C₁₋₆アルキル基又はC₃₋₈シクロアルキル基」で置換されたカ

ルバモイル基、

ベンジル基、

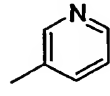
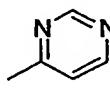
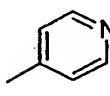
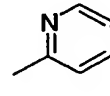
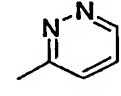
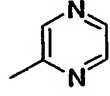
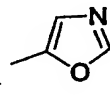
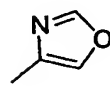
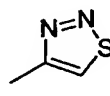
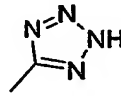
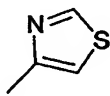
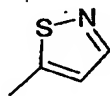
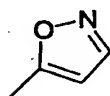
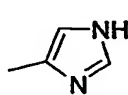
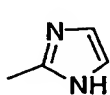
「 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基及びハロゲン原子」から
選ばれる基で置換されたベンジル基、

ベンジルスルホニル基又は

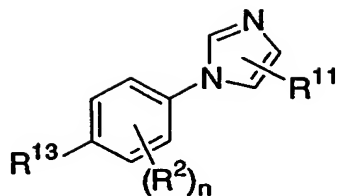
C_{1-6} アルキルスルホニル基である。] で表される基である。}

で表されるヘテロ環誘導体又はその製薬学的に許容される塩を有効成分として含むことを特徴とする20-HETE産生酵素阻害剤。

2. R^1 が下記式で示されるヘテロ環基（当該ヘテロ環基は C_{1-4} アルキル基で置換されていてもよい。）である請求の範囲1記載のヘテロ環誘導体又はその製薬学的に許容される塩を有効成分として含むことを特徴とする20-HETE産生酵素阻害剤。



3. 式



{式中、 R^2 は水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はハロゲン原子であり、

n は1～4の整数であり、

R^{11} は水素原子又は C_{1-4} アルキル基であり、

R^{13} はモルホリノ基

C_{3-10} シクロアルコキシ基、

1-フェニル-2-プロピニルオキシ基、

式 $R^{14}-A-O-$

[式中、

A は C_{1-10} アルキレン基であり、

R^{14} は C_{3-10} シクロアルキル基、

C_{1-10} アルコキシ基、

C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルコキシ基、

C_{2-14} アルカノイル基、

ジオキサニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

C_{1-6} アルキル基で置換されたジオキサニル基、

ベンゾジオキサニル基、

C_{1-6} アルキルチオ基、

ビスクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、

N,N -ジ C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルコキシ基、

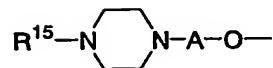
ピロリル基、

フリル基、

チエニル基又は

2-オキソピロリジン-1-イル基である。] で表される基又は

式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R¹⁵は水素原子、

C₁₋₆アルキル基、

ヒドロキシエチル基、

オキサニルメチル基、

ピリジルメチル基、

2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基、

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基、

4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、

N-アセチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、

オキサニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イル-カルボニル基、

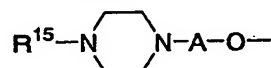
C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-

イル基」で置換された C_{2-6} アルカノイル基、
 3- (4-メチルシクロヘキシル) プロピオニル基、
 2- (2-オキソピロリジン-1-イル) アセチル基、
 3-メチル-2-ブテノイル基、
 カルバモイル基、
 「 C_{1-6} アルキル基又は C_{3-8} シクロアルキル基」で置換されたカル
 バモイル基、
 ベンジルスルホニル基又は
 C_{1-6} アルキルスルホニル基である。】で表される基である。}

で表されるイミダゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

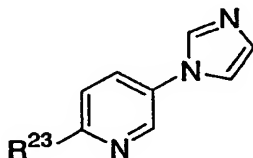
4. R^{13} が式



で表される基である請求の範囲 3 記載のイミダゾール誘導体又はその製薬学的に
 許容される塩。

5. R^{15} が C_{2-6} アルコキシカルボニル基、 C_{2-14} アルカノイル基、「1~6
 個のハロゲン原子又は C_{3-8} シクロアルキル基」で置換された C_{2-6} アルカノイ
 ル基、 C_{3-8} シクロアルキル C_{2-6} アルキル基又はオキソラニルメチル基である
 請求の範囲 4 記載のイミダゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

6. 式、



{式中、 R^{23} は、

C_{1-14} アルコキシ基、

1～6個のハロゲン原子で置換されたC₂₋₁₄アルコキシ基、

C₃₋₁₀シクロアルコキシ基、

C₂₋₁₄アルケニルオキシ基、

C₃₋₁₄アルキニルオキシ基、

式 R²⁴-A-O-

[式中、AはC₁₋₁₀アルキレン基であり、

R²⁴はC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₁₀アルコキシ基、

C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルコキシ基、

C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

オキセタニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基、

C₁₋₆アルキルチオ基、

C₄₋₁₀シクロアルケニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基、

ピロリル基、

ピリジル基、

カルバゾリル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基、

フェニル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基」から選ばれる基の1又は2個で置換されたフェニル基、

アミノ基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、

アニリノ基、

N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該アニリノ基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

ベンジルアミノ基、

N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキルアミノ基、

モルホリノ基、

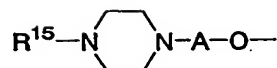
C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、

ペルヒドロアゾシン-1-イル基、

ペルヒドロアゼピン-1-イル基、

2-オキソピロリジン-1-イル基] で表される基又は

式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R¹⁵は水素原子、

C₁₋₆アルキル基、

ヒドロキシエチル基、

オキシラニルメチル基、

ピリジルメチル基、

2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基、

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基、

4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、

N-アセチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イルカルボニル基、

オキシラニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イルカルボニル基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基、

3-(4-メチルシクロヘキシル)プロピオニル基、

2-(2-オキソピロリジン-1-イル)アセチル基、

3-メチル-2-ブテノイル基、

カルバモイル基、

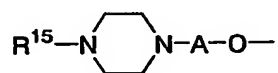
「C₁₋₆アルキル基又はC₃₋₈シクロアルキル基」で置換されたカルバモイル基、

ベンジルスルホニル基又は

C₁₋₆アルキルスルホニル基である。]で表される基である。}

で表されるイミダゾール-1-イル-ピリジン誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

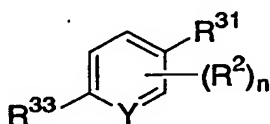
7. R^{23} が式



で表される基である請求の範囲6記載のイミダゾール-1-イル-ピリジン誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

8. R^{15} が C_{2-6} アルコキシカルボニル基、 C_{2-14} アルカノイル基、「1~6個のハロゲン原子又は C_{3-8} シクロアルキル基」で置換された C_{2-6} アルカノイル基、 C_{3-8} シクロアルキル C_{2-6} アルキル基、オキサニルメチル基である請求の範囲7記載のイミダゾール-1-イル-ピリジン誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

9. 式



{式中、Yは炭素原子又は窒素原子であり、

R^2 は水素原子、 C_{1-4} アルキル基、 C_{1-4} アルコキシ基又はハロゲン原子であり、
nは1~4の整数であり、

R^{31} は C_{1-4} アルキル基で置換されてもよいピラゾール-3-イル基、イソキサゾール-5-イル基、イソチアゾール-5-イル基、1,2,4-トリアゾール-1-イル基、ピラジン-2-イル基であり、

R^{33} は4- C_{1-6} アルコキシカルボニルピペラジン-1-イル-プロピル基、

1~6個のハロゲン原子で置換された C_{2-14} アルコキシ基、

C_{3-10} シクロアルコキシ基、

C₂₋₁₄アルケニルオキシ基、

C₃₋₁₄アルキニルオキシ基、

1-フェニル-2-プロピニルオキシ基

ビス(N,N-ジメチルアミノメチル)メトキシ基、

式 R³⁴-A-O-

[式中、

AはC₁₋₁₀アルキレン基であり、

R³⁴はC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₃₋₁₀シクロアルキル基、

C₁₋₁₀アルコキシ基、

C₋₆アルコキシC₁₋₆アルコキシ基、

C₂₋₁₀アルケニルオキシ基、

C₂₋₁₀アルカノイル基、

オキシラニル基、

ジオキシラニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキシラニル基、

オキサニル基、

ジオキサニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたジオキサニル基、

オキセタニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたオキセタニル基、

ベンゾジオキサニル基、

C₁₋₆アルキルチオ基、

C₄₋₁₀シクロアルケニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたC₄₋₁₀シクロアルケニル基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシ基、

ビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、

ピロリル基、

フリル基、

チエニル基、

ピリジル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、ヒドロキシメチル基、N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル基、4-エトキシカルボニルピペラジノメチル基又はピペリジノメチル基」で置換されたピリジル基、

2-ピリジルオキシ基、

カルバゾリル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

ピロリジニル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピロリジニル基、

ピペリジル基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたピペリジル基、

フェニル基、

「C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ハロゲン原子、フェニルエチル基、フェノキシ基、シアノ基、メチルチオ基及びN,N-ジメチルアミノ基、」から選ばれる基の1又は2個で置換されたフェニル基、

アミノ基、

N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノ基、

アニリノ基、

N-C₁₋₆アルキルアニリノ基（当該アニリノ基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

ベンジルアミノ基、

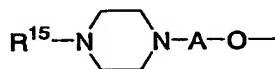
N-C₁₋₆アルキル-N-ベンジルアミノ基（当該ベンジル基はC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基又はハロゲン原子で置換されてもよい。）、

モルホリノ基、

C₁₋₆アルキル基で置換されたモルホリノ基、

ペルヒドロアゾシン-1-イル基、
 ペルヒドロアゼピン-1-イル基、
 2-オキソピロリジン-1-イル基、
 4-カルボキシピペリジノカルボニル基、
 N,N-ジC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル
 アミノ基、
 アジリジン-1-イル基、
 1-C₁₋₆アルキル-2-オキソピペラジン-4-イル基、
 「カルボキシル基、モルホリノカルボニル基、ピロリジン-1-イ
 ル-カルボニル基、ピペリジノカルボニル基、C₁₋₆アルキル基で
 置換されたカルバモイル基、ピペリジノメチル基、ピロリジン-
 1-イル-メチル基、モルホリノメチル基又はN,N-ジC₁₋₆アル
 キルアミノC₁₋₆アルキル基」で置換されたピペリジノ基、
 イミダゾリン-2-オン-1-イル基又は
 オキサゾリジン-1-イル基である。」で表される基又は

式



[式中、

Aは前記と同意義であり、

R¹⁵は水素原子、

C₁₋₆アルキル基、

ヒドロキシエチル基、

オキサラニルメチル基、

ピリジルメチル基、

2-(ピロリジン-1-イル)エチル基、

C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル基、

N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノC₁₋₄アルキル基、

C₂₋₆アルコキシカルボニル基、

C₃₋₈シクロアルキルカルボニル基、

4-メトキシシクロヘキシルカルボニル基、

N-アセチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、

N-メチルピペリジン-4-イル-カルボニル基、

オキシラニルカルボニル基、

N-Boc-ピロリジン-2-イル-カルボニル基、

C₂₋₁₄アルカノイル基、

「1~6個のハロゲン原子、C₃₋₈シクロアルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、ピペリジノ基、アセチル基、シアノ基、N,N-ジC₁₋₄アルキルアミノ基又は4-オキソ-2-チオキソチアゾリジン-3-イル基」で置換されたC₂₋₆アルカノイル基、

3-(4-メチルシクロヘキシル)プロピオニル基、

2-(2-オキソピロリジン-1-イル)アセチル基、

3-メチル-2-ブテノイル基、

カルバモイル基、

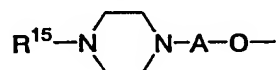
「C₁₋₆アルキル基又はC₃₋₈シクロアルキル基」で置換されたカルバモイル基、

ベンジルスルホニル基又は

C₁₋₆アルキルスルホニル基である。]で表される基である。}

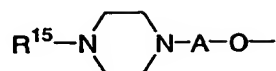
で表されるアゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

10. Yが炭素原子であり、R³³が式



で表される基である請求の範囲9記載のアゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

11. Yが炭素原子であり、R³¹がピラゾール-3-イル基であり、R³³が式



で表される基である請求の範囲 9 記載のアゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

12. R^{15} が C_{2-6} アルコキシカルボニル基、 C_{2-14} アルカノイル基、「1～6個のハロゲン原子又は C_{3-8} シクロアルキル基」で置換された C_{2-6} アルカノイル基、 C_{3-8} シクロアルキル C_{2-6} アルキル基又はオキサニルメチル基である請求の範囲 10 又は 11 記載のアゾール誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

13. 以下の化合物群から選ばれるヘテロ環誘導体又はその製薬学的に許容される塩。

エチル 4-[2-(4-イソオキサゾール-5-イル-フェノキシ)エチル]
ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}
ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4-{2-[2-メチル-4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}
ピペラジン-1-カルボキシレート

1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}
ピペラジン-1-イル)-ブタン-1-オン

1-(4-{2-[4-(2H-ピラゾール-3-イル)フェノキシ]エチル}
ピペラジン-1-イル)エタノン

エチル 4- {3- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] プロピル} ピペラジン-1-カルボキシレート

1- [4- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-カルボニル) ピペリジン-1-イル] エタノン

4, 4, 4-トリフルオロ-1- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) ブタン-1-オン

2-シクロプロピル-1- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) エタノン

4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-カルボキシリックアシッド シクロペンチルアミド

3-メチル-1- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) -2-ブテン-1-オン

シクロプロピル- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) メタノン

1- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) ヘキサン-1-オン

3, 3-ジメチル-1- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) ブタン-1-オン

4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-カルボキシリックアシッド ブチルアミド

イソプロピル 4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-カルボキシレート

1-シクロヘキシルメチル-4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン

1- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} -4- (テトラヒドロフラン-3-イルメチル) ピペラジン

3- [2-オキソ-2- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) エチル] -2-チオキソ-チアゾリジン-4-オン

1- [2-オキソ-2- (4- {2- [4- (2H-ピラゾール-3-イル) フェノキシ] エチル} ピペラジン-1-イル) エチル] ピロリジン-2-オン

エチル 4- [2- (4-イミダゾール-1-イル-フェノキシ) エチル] ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4- [2- (4-イソチアゾール-5-イル-フェノキシ) エチル] ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4- [2- (4-ピラジン-2-イル-フェノキシ) エチル] ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4- [2- (5-イソオキサゾール-5-イル-ピリジン-2-イルオキシ) エチル] ピペラジン-1-カルボキシレート

エチル 4- {2- [5- (2H-ピラゾール-3-イル) ピリジン-2-イ

ルオキシ] エチル} ピペラジン-1-カルボキシレート

14. 請求の範囲3～13のいずれか記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩を有効成分とする医薬。

15. 20-HETE産生酵素阻害剤である請求の範囲14記載の医薬。

16. 腎疾患、脳血管疾患又は循環器疾患治療薬である請求の範囲14記載の医薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/09054

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D231/12, 261/08, 401/04, 401/14, 403/12, 405/12, 405/14, 409/12, 413/12, 413/14, 417/12, 417/14, A61K31/395, 31/42, 31/422, 31/4439, 31/454, 31/496, 31/5377, 31/4245,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D, A61K, A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPIL (QUESTEL)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,A	WO 01/68610 A1 (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.), 20 September, 2001 (20.09.01), Claims (Family: none)	1-16
P,A	WO 01/96309 A1 (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.), 20 December, 2001 (20.12.01), Claims (Family: none)	1-16
P,A	JP 2001-354658 A (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.), 25 December, 2001 (25.12.01), Claims (Family: none)	1-16

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not

considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing

date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is

cited to establish the publication date of another citation or other

special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other

means

"P" document published prior to the international filing date but later

than the priority date claimed

"T"

later document published after the international filing date or

priority date and not in conflict with the application but cited to

understand the principle or theory underlying the invention

"X"

document of particular relevance; the claimed invention cannot be

considered novel or cannot be considered to involve an inventive

step when the document is taken alone

"Y"

document of particular relevance; the claimed invention cannot be

considered to involve an inventive step when the document is

combined with one or more other such documents, such

combination being obvious to a person skilled in the art

"&"

document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

09 December, 2002 (09.12.02)

Date of mailing of the international search report

24 December, 2002 (24.12.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/JP02/09054

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,A	JP 2001-354656 A (Taisho Pharmaceutical Co., Ltd.), 25 December, 2001 (25.12.01), Claims (Family: none)	1-16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/09054

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/4196, 31/4198, 31/427, 31/4155, 31/4545, 31/55, A61P9/00,
9/08, 13/12, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both
national classification and IPC)

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D231/12, 261/08, 401/04, 401/14, 403/12, 405/12, 405/14, 409/12, 413/12, 413/14, 417/12, 417/14, A61K31/395, 31/42, 31/422, 31/4439, 31/454, 31/496, 31/5377, 31/4245, 31/4196, 31/4198, 31/427, 31/4155, 31/4545, 31/55, A61P9/00, 9/08, 13/12, 43/00		
B. 調査を行った分野 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC)) Int. Cl ⁷ C07D, A61K, A61P		
最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調査で使用了電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語) CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPIL (QUESTEL)		
C. 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PA	WO 01/68610 A1 (大正製薬株式会社) 2001. 09. 20 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-16
PA	WO 01/96309 A1 (大正製薬株式会社) 2001. 12. 20 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-16
PA	JP 2001-354658 A (大正製薬株式会社) 2001. 12. 25 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-16
<input checked="" type="checkbox"/> C欄の続きにも文献が列挙されている。 <input type="checkbox"/> パテントファミリーに関する別紙を参照。		
* 引用文献のカテゴリー 「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す) 「O」 口頭による開示、使用、展示等に関する文献 「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願日の後に公表された文献 「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの 「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの 「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの 「&」 同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了した日 09. 12. 02	国際調査報告の発送日 24.12.02	
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 岡崎 美穂 電話番号 03-3581-1101 内線 3452	

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PA	JP 2001-354656 A (大正製薬株式会社) 2001. 12. 25 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-16